

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2003-040864

(43)Date of publication of application : 13.02.2003

(51)Int.Cl.

C07D207/327
 A01N 43/36
 A01N 43/40
 A01N 43/52
 A01N 43/56
 A01N 43/713
 A01N 47/24
 A01N 57/24
 A61K 31/402
 A61K 31/41
 A61P 33/14
 C07D207/333
 C07D207/34
 C07D257/04

(21)Application number : 2002-145526

(71)Applicant : NISSAN CHEM IND LTD

(22)Date of filing : 21.05.2002

(72)Inventor : MITA TAKESHI
 NUMATA AKIRA
 TERACHI TAKUMI
 MIYAKE TOSHIRO
 TAKI SHINJI
 ITO TOSHINORI

(30)Priority

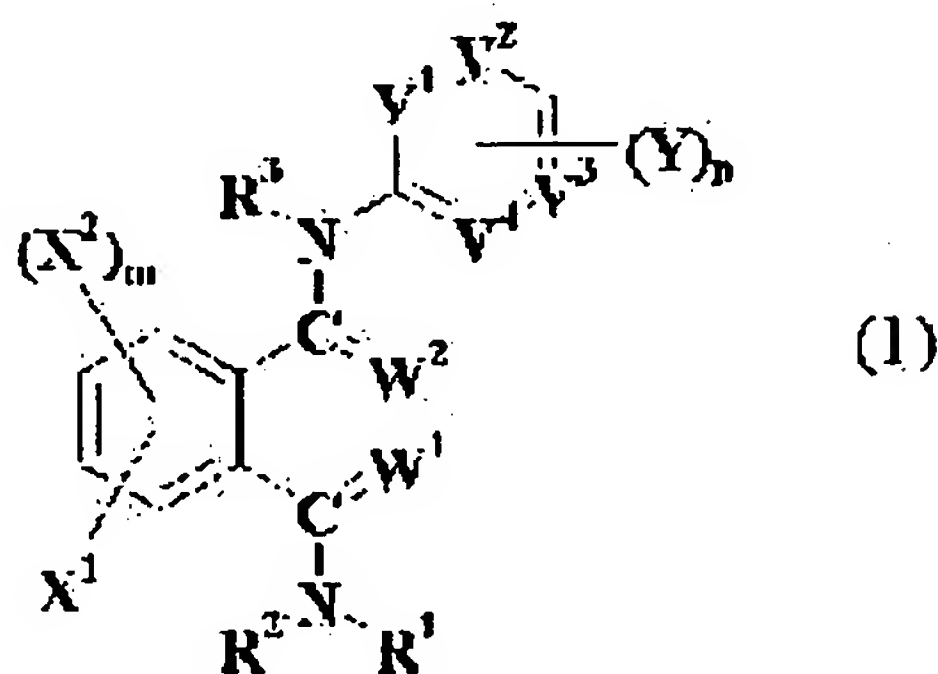
Priority number : 2001151314 Priority date : 21.05.2001 Priority country : JP

(54) PHTHALIC ACID DIAMIDE COMPOUND AND PEST-CONTROLLING AGENT

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a new agrochemical, especially an insecticidal and acaricidal agent.

SOLUTION: The phthalic acid diamide compound represented by general formula (1) [wherein, V1 to V4 are each a carbon atom or a nitrogen atom; W1 and W2 are each independently an oxygen atom or a sulfur atom; X1 is pyrrole, tetrazole or the like; X2 is a hydrogen atom, a halogen atom, a 1-6C alkyl or the like; Y is a halogen atom, a 1-6C alkyl, a 1-6C haloalkyl, a 1-6C haloalkoxy, a 1-6C haloalkoxy-1-6C haloalkoxy or the like; R1 is a 1-6C alkyl, a 1-6C alkylthio-1-6C alkyl, a 1-6C alkylsulfinyl-1-6C alkyl, a 1-6C alkylsulfonyl-1-6C alkyl, a 1-6C alkoxyimino-1-6C alkyl or the like; R2 and R3 are each independently a hydrogen atom, a 1-6C alkyl or the like; m is an integer of 1-3; and n is an integer of 1-5], the salt thereof, and the pest-controlling agent containing the compound are provided.



LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2003-40864

(P2003-40864A)

(43)公開日 平成15年2月13日(2003.2.13)

(51)Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テ-マ-ト*(参考)
C 0 7 D 207/327		C 0 7 D 207/327	4 C 0 6 9
A 0 1 N 43/36		A 0 1 N 43/36	A 4 C 0 8 6
43/40	1 0 1	43/40	1 0 1 J 4 H 0 1 1
43/52		43/52	
43/56		43/56	G

審査請求 未請求 請求項の数4 O L (全 76 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2002-145526(P2002-145526)
(22)出願日 平成14年5月21日(2002.5.21)
(31)優先権主張番号 特願2001-151314(P2001-151314)
(32)優先日 平成13年5月21日(2001.5.21)
(33)優先権主張国 日本(J P)

(71)出願人 000003986
日産化学工業株式会社
東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(72)発明者 三田 猛志
千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社物質科学研究所内
(72)発明者 沼田 昭
千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社物質科学研究所内
(72)発明者 寺地 拓己
千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学
工業株式会社物質科学研究所内

最終頁に続く

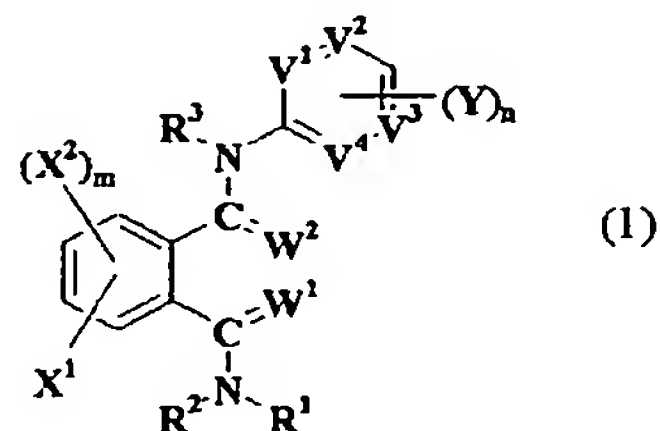
(54)【発明の名称】 フタル酸ジアミド化合物及び有害生物防除剤

(57)【要約】

【課題】 新規な農薬、特に殺虫・殺ダニ剤を提供する。

【解決手段】 一般式(1)：

【化1】



〔式中、V¹~V⁴は炭素原子又は窒素原子を表し、W¹及びW²は各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、X¹はピロール又はテトラゾール等を表し、X²は水素原子、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキル等を表し、Yはハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆ハロアルコキシ又はC₁~C₆ハロアルコキシ(C₁~C₆)ハロアルコキシ等を表し、R¹はC₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルキルチオ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルスルフィニル(C

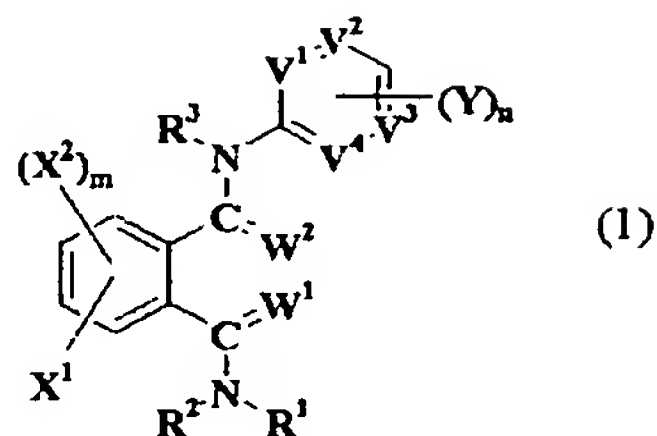
1~6)アルキル、C₁~C₆アルキルスルホニル(C₁~C₆)アルキル又はC₁~C₆アルコキシイミノ(C₁~C₆)アルキル等を表し、R²及びR³は各々独立して水素原子又はC₁~C₆アルキル等を表し、mは1~3の整数を表し、nは1~5の整数を表す。〕で表されるフタル酸ジアミド化合物又はその塩、及び該化合物を含有する有害生物防除剤。

1

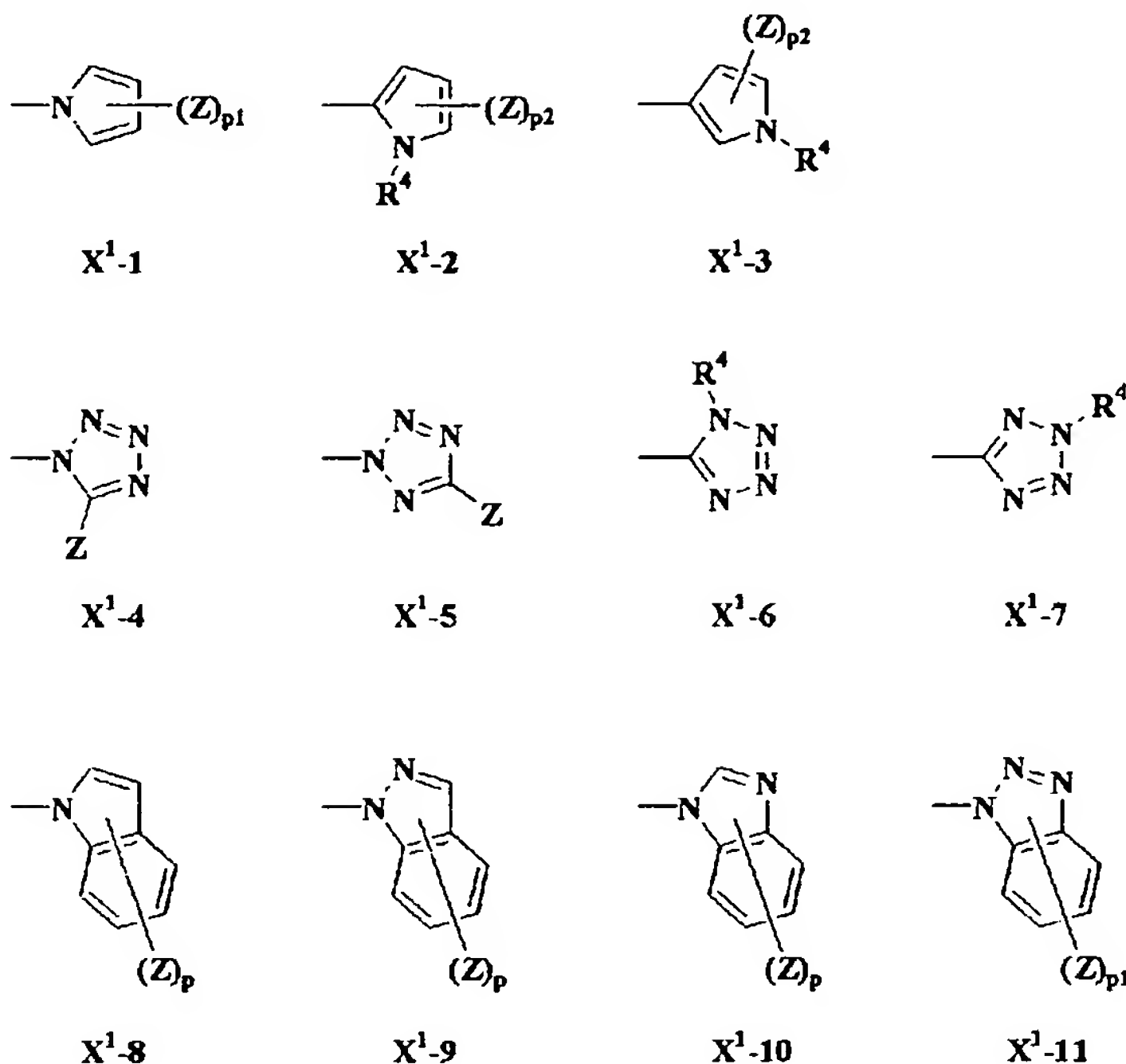
【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式(1)：

【化1】



* 10



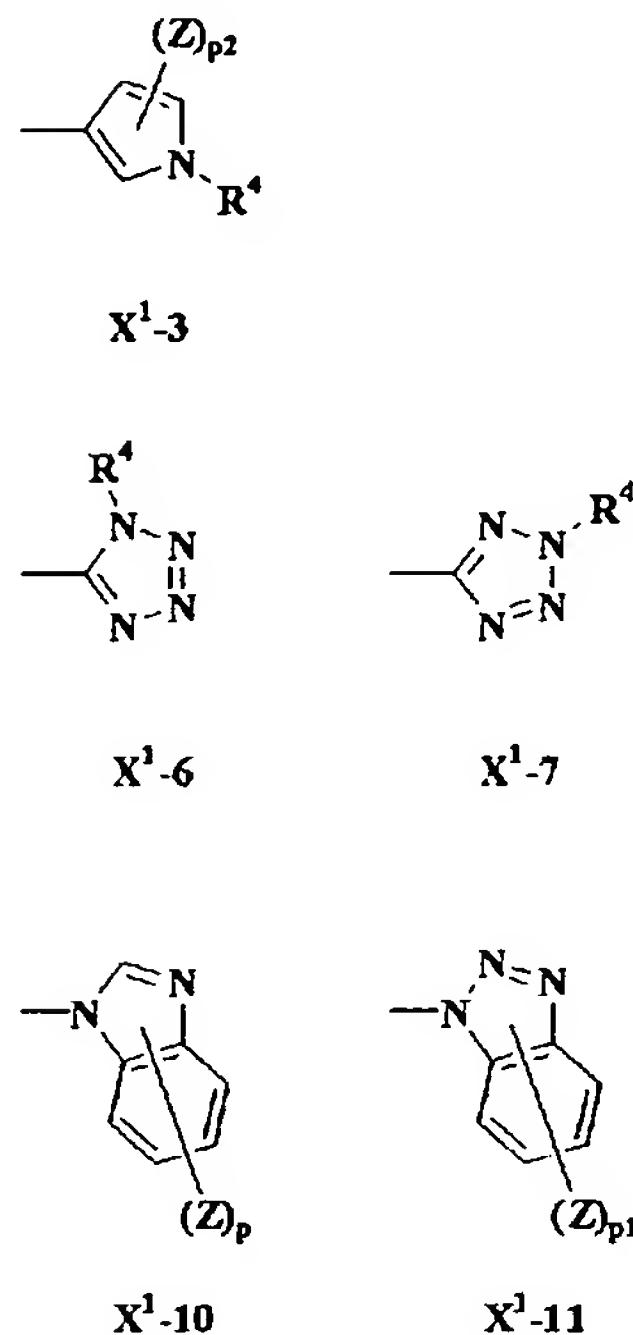
X²は、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ又はC₁~C₆ハロアルキルチオを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のX²は互いに同一であっても、または相異なってもよく、Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、-SCN、-SF₅、ニトロ、アジド、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₂~C₆アルキニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルキニル、-OH、-OR⁶、-OCHO、-SH、-SR⁶、-S(O)R⁶、-S(O)₂R⁶、-NHR⁷、-N(R⁷)R⁶、-N(R⁷)CHO、-CHO、-C(O)R⁸、-C(O)OR⁸、-C(O)SR⁸、-C(S)OR⁸、-C(S)SR⁸、-C(O)NHR⁹、-C(O)N(R⁹)R⁸、-CH=NOR¹⁰、-C(=NOR¹⁰)R⁸、-C(=NOR¹⁰)OR⁸、-C(=NOR¹⁰)SR⁸、-C(=NOR¹⁰)NH(R⁹)、-C(=NOR¹⁰)N(R⁹)R⁸、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、-P(O)(R¹⁴)(OR¹¹)、-SiR¹²R¹³R¹⁴、(Z)_pによって置換されていてもよ

* [式中、V¹、V²、V³及びV⁴は、各々独立して炭素原子又は窒素原子を表し、

W¹及びW²は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

X¹は、式X¹-1から式X¹-11の何れかで表される複素環を表し、

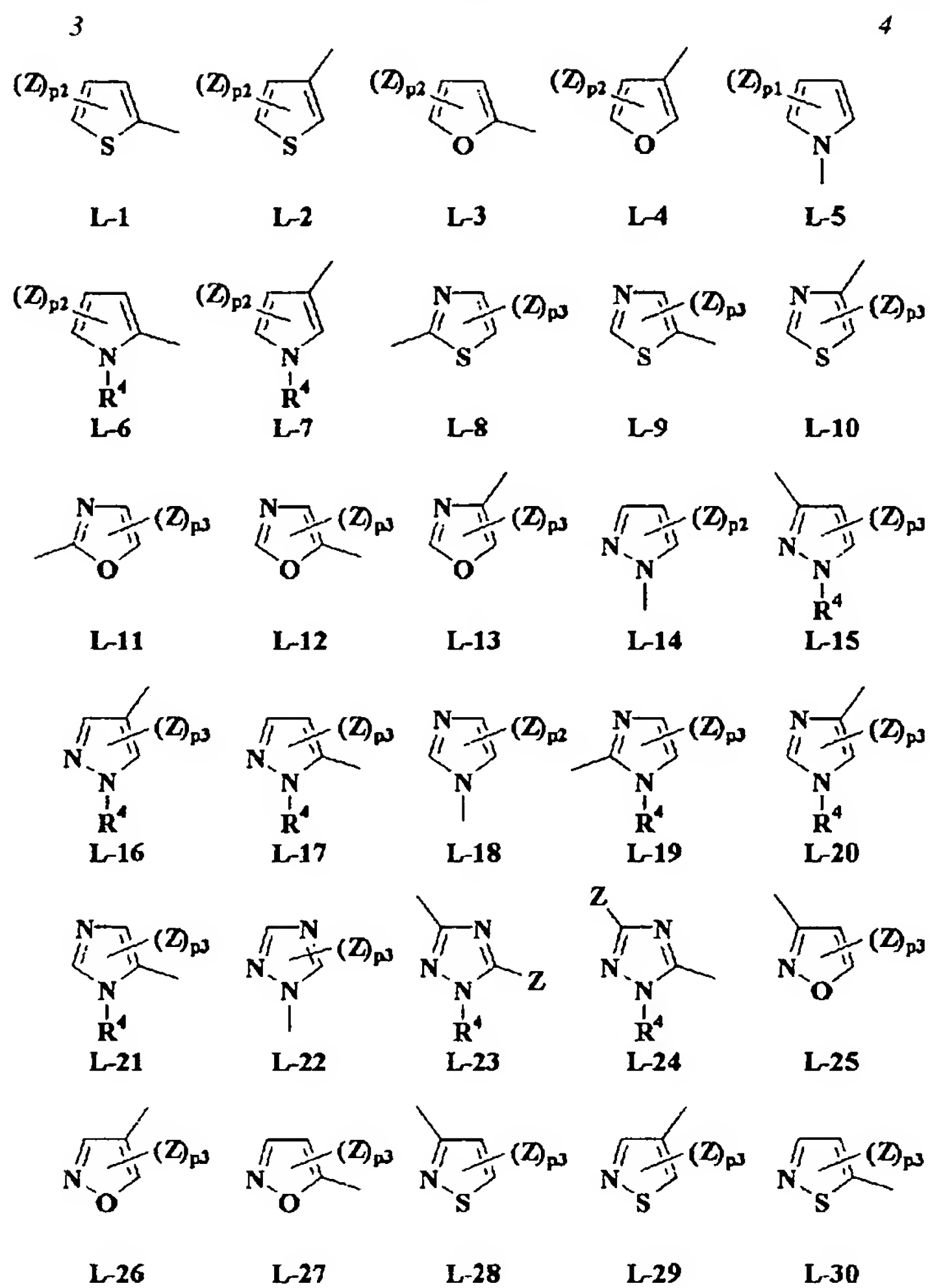
【化2】



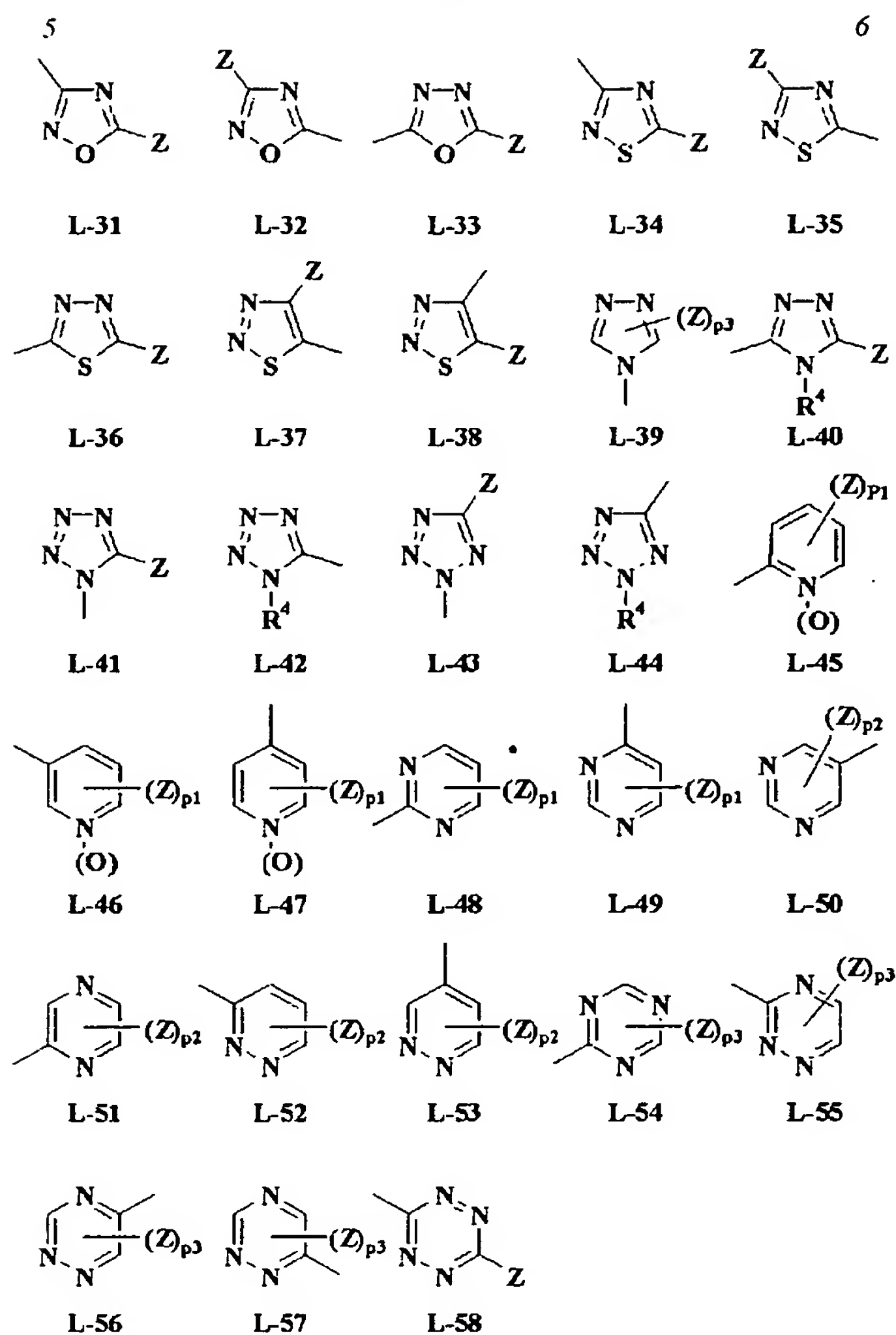
いフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のYは互いに同一であっても、または相異なってもよく、更に、nが2であり、且つ2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂CH₂O-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N(R⁴)-, -CH₂N(R⁴)CH₂-, -CH₂CH=CH-, -OCH=CH-, -SCH=C H-, -N(R⁴)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R⁴)CH=N-, -N(R⁴)N=CH-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂CH₂-, -OCH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂O-, -CH=CHCH=CH-, -N=CHCH=CH-又は-N=CHN=CH-を形成することによりYが結合する原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、この時、各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁵によって任意に置換されていてもよく、

Lは、式L-1から式L-58までの何れかで表される芳香族複素環を表し、

【化3】

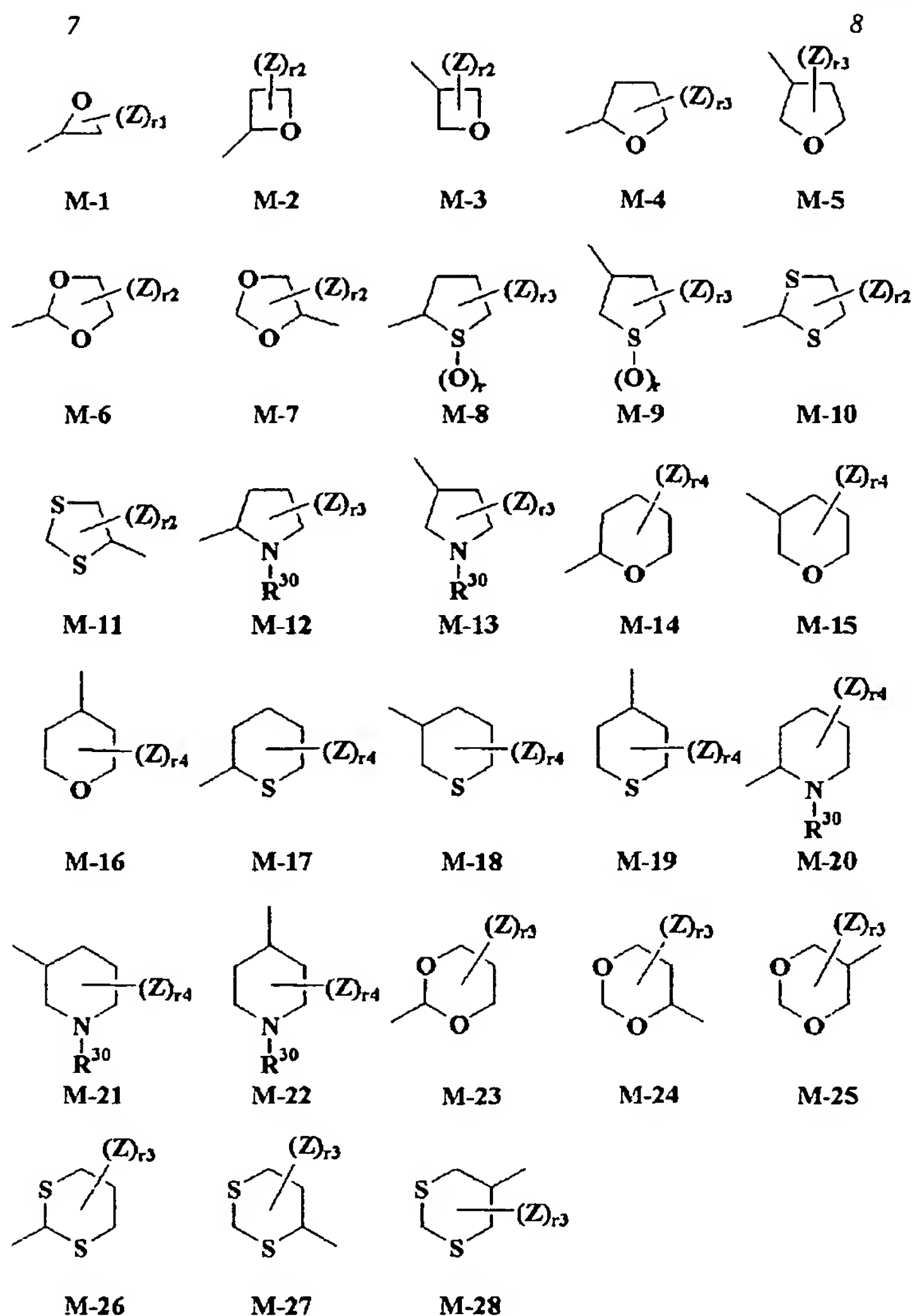


【化4】



Mは、式M-1から式M-28までの何れかで表される脂肪族複 30 【化5】

素環を表し、



R^1 , R^2 及び R^3 は、各々独立して水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{16} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{16} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{16} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) アルキニル、 $-O$ R^{17} 、 $-N(R^{18})R^{17}$ 、 $-SR^{19}$ 、 $-S(O)_2R^{19}$ 、 $-SN(R^{21})R^{20}$ 、 $-S$ $N(R^{23})C(O)OR^{22}$ 、 $-S(O)_2N(R^{25})R^{24}$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)O$ R^8 、 $-C(O)SR^8$ 、 $-C(S)R^8$ 、 $-C(S)OR^8$ 、 $-C(S)SR^8$ 、 $-C(O)N$ $(R^{25})R^{24}$ を表すか、或いは、 R^1 と R^2 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を 0～2 個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカル

ボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニル又は $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニルによって置換された ($C_1 \sim C_4$) アルキルを表し、

R^5 は、ハロゲン原子、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{26}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{26}$ 、 $-S(O)$ R^{26} 、 $-S(O)_2R^{26}$ 、 $-NHR^{27}$ 、 $-N(R^{27})R^{26}$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $-SiR^{12}R^{13}R^{14}$ 、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_q$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{28} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{28} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{28} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^8$ 、 $-C(O)N(R^9)R^8$ 、 $-S(O)_2R^8$ 、 $-S(O)_2N(R^9)R^8$ 、 $-P(O)(OR^{11})_2$ 、 $-P(S)(OR^{11})_2$ 、 $(Z)_p$ によ

って置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、-CHO、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルカルボニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルコキシカルボニルを表すか、或いは、R⁶とR⁷とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

R⁸は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R⁹は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル又はC₃~C₆アルキニルを表すか、或いは、R⁸とR⁹とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

R¹⁰は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、

R¹¹は、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、

R¹²及びR¹³は、各々独立してC₁~C₆アルキルを表し、

R¹⁴は、C₁~C₆アルキル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルを表し、

R¹⁵は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロアルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁

~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルアミノ、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、更に、同時に2個以上のR¹⁵で置換されている場合、各々のR¹⁵は互いに同一であっても、または相異なってもよく、

R¹⁶は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、-CHO、-C(O)R⁸、-C(O)OR⁸、-C(O)SR⁸、-C(O)N(R⁹)R⁸、-C(O)C(O)OR⁸、-CH=NOR¹⁰、-C(=NOR¹⁰)R⁸、-OR²⁹、-N(R³⁰)R²⁹、-SH、-SR³¹、-S(O)R³¹、-S(O)₂R³¹、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、-P(7I2H)₂、-P(O)(7I2H)₂、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R¹⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、

R¹⁸は、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

R¹⁹は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R²⁰及びR²¹は、各々独立してC₁~C₁₂アルキル、C₁~C₁₂ハロアルキル、C₂~C₁₂シアノアルキル、C₁~C₁₂アルコキシ(C₁~C₁₂)アルキル、C₁~C₁₂アルコキシカルボニル(C₁~C₁₂)アルキル、C₃~C₁₂アルケニル、C₃~C₁₂ハロアルケニル、C₃~C₁₂アルキニル、C₃~C₁₂ハロアルキニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルを表すか、或いは、R²⁰とR²¹とが一緒になってC₄~C₇アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つC₁~C₄アルキルによって置換されていてもよく、

R²²は、C₁~C₁₂アルキルを表し、

R²³は、C₁~C₆アルキル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、

R²⁴は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₈シクロアルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₁~C₆アルコキシ

(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、(Z)_pによって置換されていてもよいベンジルオキシ、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいベンジルを表し、

R²⁵は、水素原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表すか、或いは、R²⁴とR²⁵とが一緒になってC₄~C₇アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つC₁~C₄アルキルによって置換されていてもよく、

R²⁶は、C₁~C₆アルキル、R³²によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、R³²によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、C₃~C₆アルキニル、R³²によって任意に置換された(C₃~C₆)アルキニル、-C(O)R⁸、-S(O)₂R⁸、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R²⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₃~C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表すか、或いは、R²⁶とR²⁷とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

R²⁸は、ハロゲン原子、シアノ、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、-OH、-OR³³、-SH、-SR³³、-S(O)R³³、-S(O)₂R³³、-NHR³⁴、-N(R³⁴)R³³、-C(O)R³³、-CHO、-C(O)OH、-C(O)OR³³又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルを表し、

R²⁹は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルチオ(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、-CHO、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノチオカルボニル、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R³⁰は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルカルボニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルコキシカルボニルを表すか、或いは、R²⁹とR³⁰とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

R³¹は、C₁~C₈アルキル、R³⁵によって任意に置換された(C₁~C₈)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、R³⁵によって任意に置換された(C₃~C₆)アルケニル、C₃~C₆アルキニル、R³⁵によって任意に置換された(C₃~C₆)アルキニル、-CHO、-C(O)R³⁶、-C(S)R³⁶、-C(=NR³⁷)R³⁶、-SH、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルチオ、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R³²は、ハロゲン原子、シアノ、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェノキシ、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルチオ、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R³³は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₈シクロアルケニル、C₃~C₈ハロシクロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

R³⁴は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表すか、或いは、R³³とR³⁴とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのア

ルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0～2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

R^{35} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-CHO$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^8$ 、 $-C(O)SR^8$ 、 $-C(O)N(R^9)R^8$ 、 $-C(O)C(O)OR^8$ 、 $-CH=NOR^{10}$ 、 $-C(=NOR^{10})R^8$ 、 $-OR^{29}$ 、 $-N(R^{30})R^{29}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{38}$ 、 $-S(O)R^{38}$ 、 $-S(O)_2R^{38}$ 、 $-P(O)(OR^{11})_2$ 、 $-P(S)(OR^{11})_2$ 、 $-P(Fin)2$ 、 $-P(O)(Fin)2$ 、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_q$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^{36} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $-OR^{39}$ 、 $-SR^{39}$ 、 $-NHR^{40}$ 、 $-N(R^{40})R^{39}$ 、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_q$ によって置換されていてもよいナフチル、 L 又は M を表し、

R^{37} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{38} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニルによって置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 L 又は M を表し、

R^{39} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_p$ によって置換されていてもよいフェニルによって置換された($C_1 \sim C_4$)アルキル、 L 又は M を表し、

R^{40} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^{39} と R^{40} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0～2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、

Z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ

カルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノ、 $-CHO$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $-CH=NO(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-C(C_1 \sim C_6$ アルキル)= $NO(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$)アルキルアミノカルボニル又はフェニルを表し、 p 、 $p1$ 、 $p2$ 、 $p3$ 、 q 、 $r1$ 、 $r2$ 、 $r3$ 又は $r4$ が2以上の整数を表すとき、各々の Z は互いに同一であっても、または相異なってもよく、更に、 $p1$ が2であり、且つ2つの Z が隣接する場合には、隣接する2つの Z は $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2C(O)-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2C(=NO(C_1 \sim C_6$ アルキル))-を形成することにより Z が結合する原子と共に6員環を形成してもよく、この時、各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル又は水酸基によって任意に置換されていてもよく、

m は、1～3の整数を表し、

n は、1～5の整数を表し、

p は、0～5の整数を表し、

$p1$ は、0～4の整数を表し、

$p2$ は、0～3の整数を表し、

$p3$ は、0～2の整数を表し、

q は、0～7の整数を表し、

r は、0～2の整数を表し、

$r1$ は、0～3の整数を表し、

$r2$ は、0～5の整数を表し、

$r3$ は、0～7の整数を表し、

$r4$ は、0～9の整数を表す。} で表されるフタル酸ジアミド化合物又はその塩。

【請求項2】 請求項1記載のフタル酸ジアミド化合物又はその塩の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

【請求項3】 請求項1記載のフタル酸ジアミド化合物又はその塩の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

【請求項4】 請求項1記載のフタル酸ジアミド化合物又はその塩の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫又は殺ダニ剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、新規なフタル酸ジアミド化合物及びその塩、並びに該化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤に関するものである。本発明における有害生物防除剤とは、農園

芸分野又は畜産、衛生分野（動物薬や家庭用、業務用殺虫剤）における有害な節足動物を対象とした害虫防除剤を意味する。また、本発明における農薬とは、農園芸分野における殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤を意味する。

【0002】

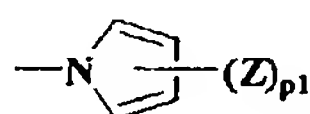
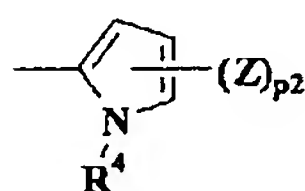
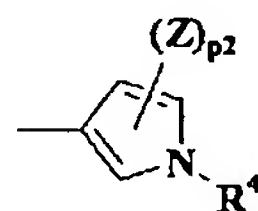
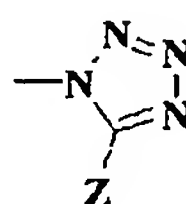
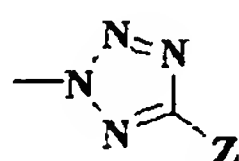
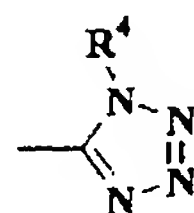
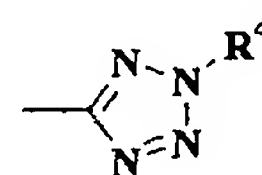
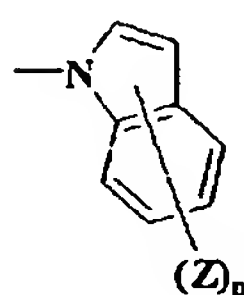
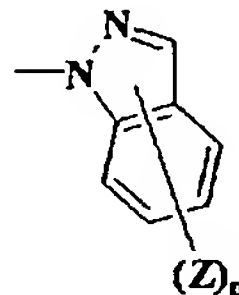
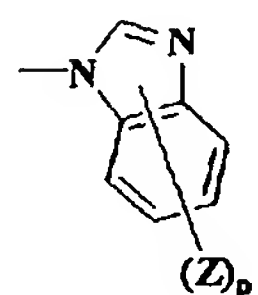
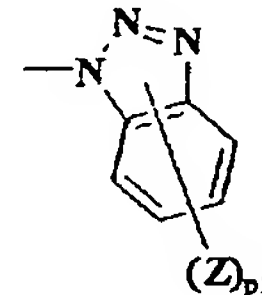
【従来の技術】従来、本発明に類似するフタル酸ジアミド誘導体に関しては、ヨーロッパ特許出願公報（EP 0,919,542号公報、EP 1,006,107号公報、）、国際特許出願公報（WO 01/00575号公報、WO 01/00599号公報、WO 01/02354号公報、WO 01/21576号公報）に殺虫活性を有することが開示されている。しかしながら、本発明に係る新規なフタル酸ジアミド化合物に関しては何ら開示されていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】有害生物防除剤、例えば殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来用いられてきた殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。また、既存の有害生物防除剤の一部のものは毒性が高く、或いはあるものは長期の残留性により、生態系を乱しつつある。このような状況下、低毒性かつ低残留性の新規な有害生物防除剤の開発が常に期待されている。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、上記の課*

X¹-1X¹-2X¹-3X¹-4X¹-5X¹-6X¹-7X¹-8X¹-9X¹-10X¹-11

【0010】X²は、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ又はC₁~C₆ハロアルキルチオを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のX²は互いに同一であっても、または相異なっていて

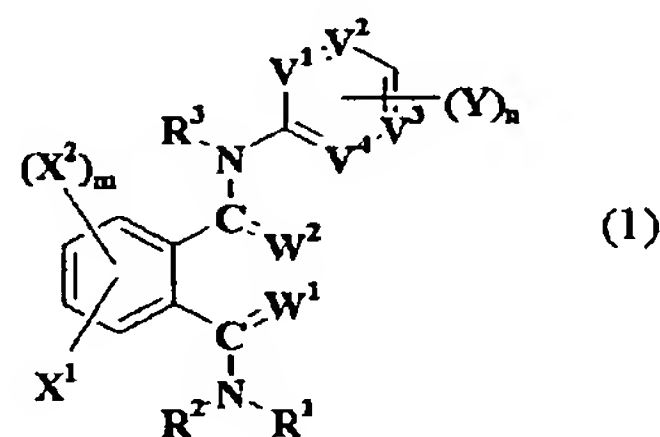
*題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る一般式（1）で表される新規なフタル酸ジアミド化合物が優れた有害生物防除活性、特に殺虫殺ダニ活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見出し、本発明を完成した。

【0005】すなわち、本発明は下記〔1〕~〔4〕に関するものである。

【0006】〔1〕 一般式（1）：

【0007】

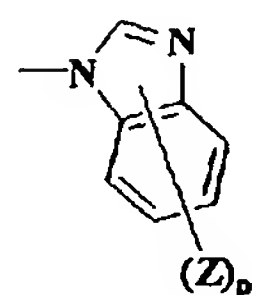
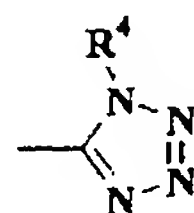
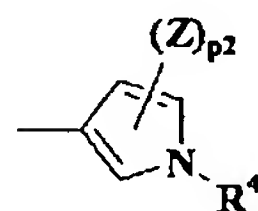
【化6】



【0008】〔式中、V¹, V², V³及びV⁴は、各々独立して炭素原子又は窒素原子を表し、W¹及びW²は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、X¹は、式X¹-1から式X¹-11の何れかで表される複素環を表し、

【0009】

【化7】



もよく、Yは、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、-SCN、-SF₅、ニトロ、アジド、C₁~C₆アルキル、R⁵によって任意に置換された(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルケニル、

17

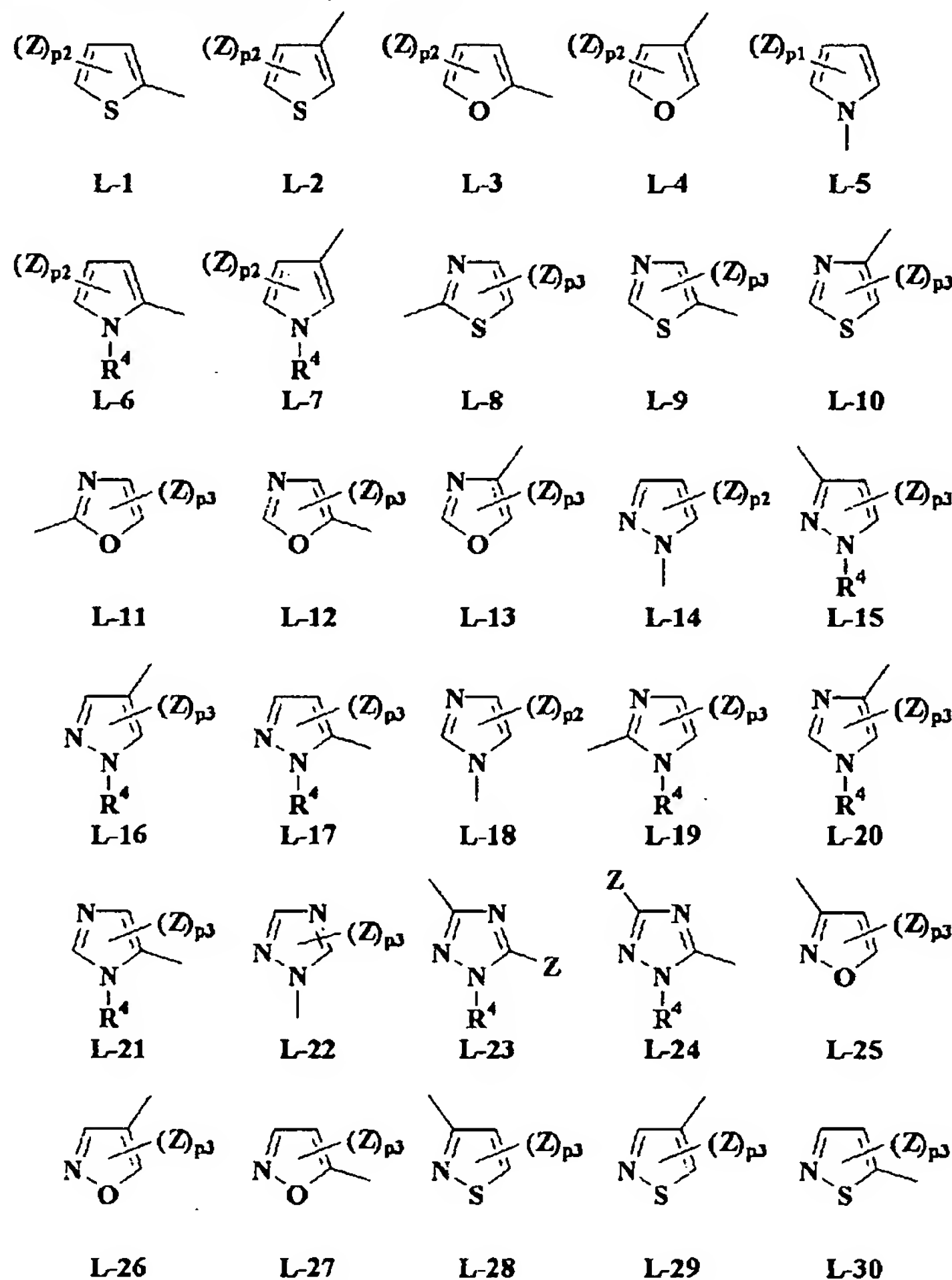
C₂~C₆アルキニル、R⁵によって任意に置換された(C₂~C₆)アルキニル、-OH、-OR⁶、-OCHO、-SH、-SR⁶、-S(O)R⁶、-S(O)₂R⁶、-NHR⁷、-N(R⁷)R⁶、-N(R⁷)CHO、-CHO、-C(O)R⁸、-C(O)OR⁸、-C(O)SR⁸、-C(S)OR⁸、-C(S)SR⁸、-C(O)NHR⁹、-C(O)N(R⁹)R⁸、-CH=NOR¹⁰、-C(=NOR¹⁰)R⁸、-C(=NOR¹⁰)OR⁸、-C(=NOR¹⁰)SR⁸、-C(=NOR¹⁰)NH(R⁹)、-C(=NOR¹⁰)N(R⁹)R⁸、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、-P(O)(R¹⁴)(OR¹¹)、-SiR¹²R¹³R¹⁴、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、nが2以上の整数を表すとき、各々のYは互いに同一であっても、または相異なっているてもよく、更に、nが2であり、且つ2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのYは-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH*

18

*2 O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N(R⁴)-, -CH₂N(R⁴)CH₂-, -CH₂CH=CH-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N(R⁴)CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N(R⁴)CH=N-, -N(R⁴)N=CH-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂CH₂-, -OCH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂O-, -CH=CHCH=CH-, -N=CHCH=CH-又は-N=CHN=CH-を形成することによりYが結合する原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、この時、各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁵によって任意に置換されていてもよく、Lは、式L-1から式L-58までの何れかで表される芳香族複素環を表し、

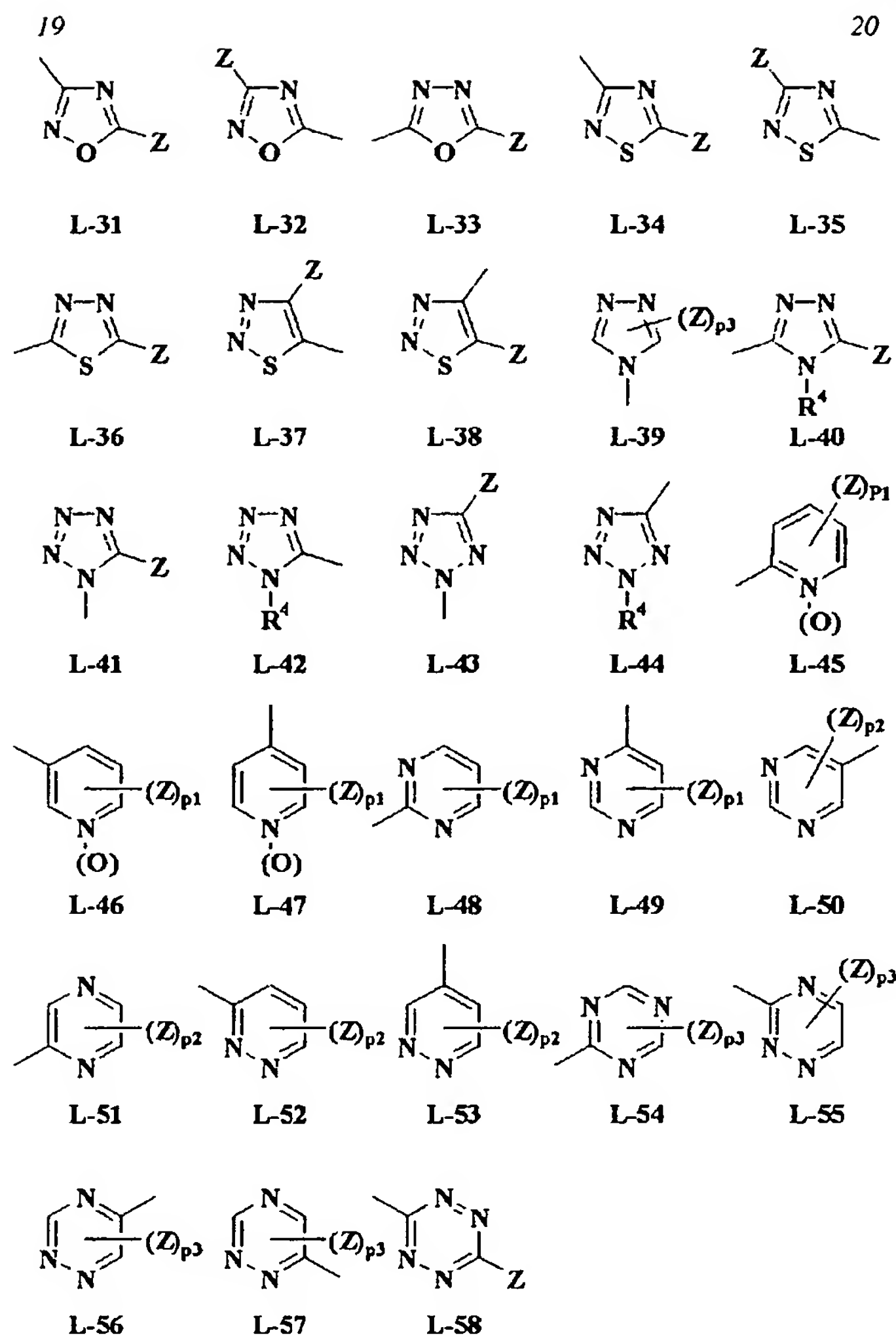
【0011】

【化8】

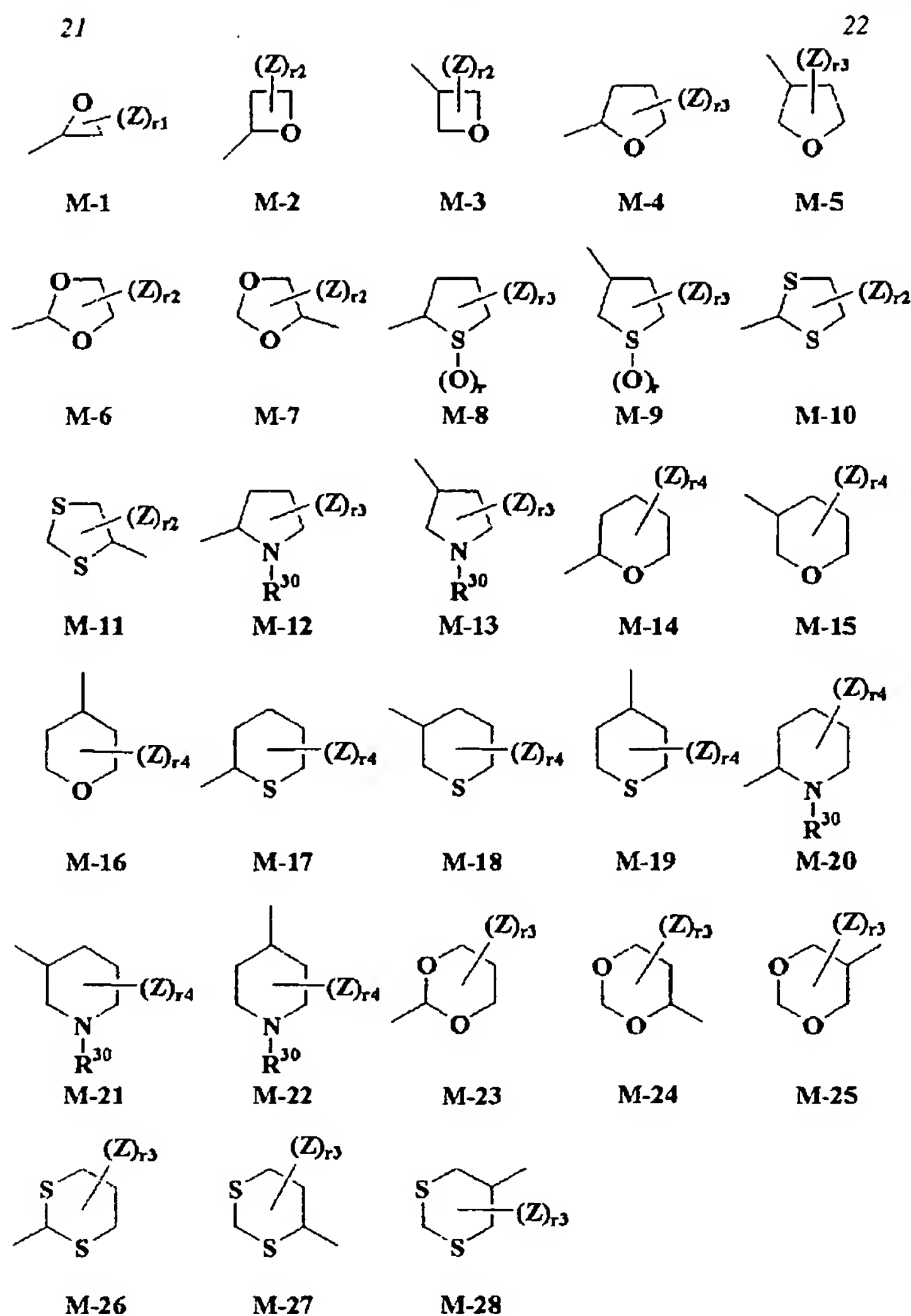


【0012】

【化9】



【0013】Mは、式M-1から式M-28までの何れかで表さ 30 【0014】
れる脂肪族複素環を表し、 【化10】



【0015】 R^1 , R^2 及び R^3 は、各々独立して水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{16} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{16} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{16} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) アルキニル、 $-OR^{17}$ 、 $-N(R^{18})R^{17}$ 、 $-SR^{19}$ 、 $-S(O)_2R^{19}$ 、 $-SN(R^{21})R^{20}$ 、 $-SN(R^{23})C(O)OR^{22}$ 、 $-S(O)_2N(R^{25})R^{24}$ 、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)OR^8$ 、 $-C(O)SR^8$ 、 $-C(S)R^8$ 、 $-C(S)OR^8$ 、 $-C(S)SR^8$ 、 $-C(O)N(R^{25})R^{24}$ を表すか、或いは、 R^1 と R^2 とが一緒

になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 3～7 員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を 0～2 個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、 R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) ア

はMを表し、R⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、-CHO、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニルカルボニル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルコキシカルボニルを表すか、或いは、R⁶とR⁷とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されているもよく、R⁸は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルチオ(C₁~C₄)アルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル、(Z)_qによって置換されているもよいナフチル、L又はMを表し、R⁹は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル又はC₃~C₆アルキニルを表すか、或いは、R⁸とR⁹とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されているもよく、R¹⁰は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、R¹¹は、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、R¹²及びR¹³は、各々独立してC₁~C₆アルキルを表し、R¹⁴は、C₁~C₆アルキル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルを表し、R¹⁵は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロアルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルアミノ、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニル、(Z)_qによって置換されているもよいナフチ

ル、L又はMを表し、更に、同時に2個以上のR¹⁵で置換されている場合、各々のR¹⁵は互いに同一であっても、または相異なっているもよく、R¹⁶は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、-CHO、-C(O)R⁸、-C(O)OR⁸、-C(O)SR⁸、-C(O)N(R⁹)R⁸、-C(O)C(O)OR⁸、-CH=NOR¹⁰、-C(=NOR¹⁰)R⁸、-OR²⁹、-N(R³⁰)R²⁹、-SH、-SR³¹、-S(O)R³¹、-S(O)₂R³¹、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、-P(7Iニル)₂、-P(O)(7Iニル)₂、(Z)_pによって置換されているもよいフェニル、(Z)_qによって置換されているもよいナフチル、L又はMを表し、R¹⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、R¹⁸は、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルカルボニルを表し、R¹⁹は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニル、(Z)_qによって置換されているもよいナフチル、L又はMを表し、R²⁰及びR²¹は、各々独立してC₁~C₁₂アルキル、C₁~C₁₂ハロアルキル、C₂~C₁₂シアノアルキル、C₁~C₁₂アルコキシ(C₁~C₁₂)アルキル、C₁~C₁₂アルコキシカルボニル(C₁~C₁₂)アルキル、C₃~C₁₂アルケニル、C₃~C₁₂ハロアルケニル、C₃~C₁₂アルキニル、C₃~C₁₂ハロアルキニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、(Z)_pによって置換されているもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルを表すか、或いは、R²⁰とR²¹とが一緒になってC₄~C₇アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つC₁~C₄アルキルによって置換されているもよく、R²²は、C₁~C₁₂アルキルを表し、R²³は、C₁~C₆アルキル又は(Z)_pによって置換されているもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキルを表し、R²⁴は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₈シクロアルキル、C₂~C₆シアノアルキル、C₁~C₆アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、(Z)_pによって置換されているもよいベンジルオキシ、(Z)_pによって置換されているもよいフェニル又は(Z)_pによって置換されているもよいベンジルを表し、R²⁵は、水素原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表すか、或いは、R²⁴とR²⁵とが一緒になってC₄~C₇アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよく、このときこのアル

キレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0～2個含んでもよく、且つC₁～C₄アルキルによって置換されていてもよく、R²⁶は、C₁～C₆アルキル、R³²によって任意に置換された(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、R³²によって任意に置換された(C₂～C₆)アルケニル、C₃～C₆アルキニル、R³²によって任意に置換された(C₃～C₆)アルキニル、-C(O)R⁸、-S(O)₂R⁸、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R²⁷は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表すか、或いは、R²⁶とR²⁷とが一緒になってC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0～2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、R²⁸は、ハロゲン原子、シアノ、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、-OH、-OR³³、-SH、-SR³³、-S(O)R³³、-S(O)₂R³³、-NHR³⁴、-N(R³⁴)R³³、-C(O)R³³、-CHO、-C(O)OH、-C(O)OR³³又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルを表し、R²⁹は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ(C₁～C₆)アルキル、C₁～C₆アルキルチオ(C₁～C₆)アルキル、C₃～C₆アルケニル、C₃～C₆ハロアルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₃～C₆ハロアルキニル、-CHO、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁～C₆)アルキルアミノカルボニル、C₁～C₆アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁～C₆)アルキルアミノチオカルボニル、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁～C₄)アルキル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R³⁰は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルカルボニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁～C₄)アルコキシカルボニルを表すか、或いは、R²⁹とR³⁰とが一緒になってC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0～2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されてい

てもよく、R³¹は、C₁～C₈アルキル、R³⁵によって任意に置換された(C₁～C₈)アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₃～C₆アルケニル、R³⁵によって任意に置換された(C₃～C₆)アルケニル、C₃～C₆アルキニル、R³⁵によって任意に置換された(C₃～C₆)アルキニル、-CHO、-C(O)R³⁶、-C(S)R³⁶、-C(=NR³⁷)R³⁶、-SH、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R³²は、ハロゲン原子、シアノ、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆ハロアルキルチオ、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいフェノキシ、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルチオ、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R³³は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、C₃～C₆アルケニル、C₃～C₆ハロアルケニル、C₃～C₈シクロアルケニル、C₃～C₆ハロシクロアルケニル、C₃～C₆アルキニル、C₃～C₆ハロアルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R³⁴は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₆アルケニル、C₃～C₆アルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表すか、或いは、R³³とR³⁴とが一緒になってC₂～C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3～6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0～2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、R³⁵は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、-CHO、-C(O)R⁸、-C(O)OR⁸、-C(O)SR⁸、-C(O)N(R⁹)R⁸、-C(O)C(O)OR⁸、-CH=NOR¹⁰、-C(=NOR¹⁰)R⁸、-OR²⁹、-N(R³⁰)R²⁹、-SH、-SR³⁸、-S(O)R³⁸、-S(O)₂R³⁸、-P(O)(OR¹¹)₂、-P(S)(OR¹¹)₂、-P(7E11)₂、-P(O)(7E11)₂、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R³⁶は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₃～C₈ハロシクロアルキル、-OR³⁹、-SR³⁹、-NHR⁴⁰、-N(R⁴⁰)R³⁹、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_qによって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、R

³⁷は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆アルキルアミノ、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノ、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルを表し、R³⁸は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル、L又はMを表し、R³⁹は、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₃~C₆アルケニル、C₃~C₆ハロアルケニル、C₃~C₆アルキニル、C₃~C₆ハロアルキニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C₁~C₄)アルキル、L又はMを表し、R⁴⁰は、水素原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル又はC₁~C₆ハロアルコキシカルボニルを表すか、或いは、R³⁹とR⁴⁰とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよく、このときこのアルキレン鎖は酸素原子又は硫黄原子を0~2個含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチルによって置換されていてもよく、Zは、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆ヒドロキシアルキル、C₁~C₄アルコキシ(C₁~C₄)アルキル、C₁~C₄アルコキシカルボニル(C₁~C₄)アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆ハロアルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₂~C₆ハロアルキニル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、C₁~C₆アルキルアミノ、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノ、-CHO、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₁~C₆ハロアルキルカルボニル、-CH=NO(C₁~C₆アルキル)、-(C₁~C₆アルキル)=NO(C₁~C₆アルキル)、C₁~C₆アルコキシカルボニル、C₁~

C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁~C₆)アルキルアミノカルボニル又はフェニルを表し、p, p1, p2, p3, q, r1, r2, r3又はr4が2以上の整数を表すとき、各々のZは互いに同一であっても、または相異なってもよく、更に、p1が2であり、且つ2つのZが隣接する場合には、隣接する2つのZは-CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂C(O)-又は-CH₂CH₂CH₂C(=NO(C₁~C₆アルキル))-を形成することによりZが結合する原子と共に6員環を形成してもよく、この時、各々の炭素原子に結合した水素原子はハロゲン原子、C₁~C₄アルキル又は水酸基によって任意に置換されていてもよく、mは、1~3の整数を表し、nは、1~5の整数を表し、pは、0~5の整数を表し、p1は、0~4の整数を表し、p2は、0~3の整数を表し、p3は、0~2の整数を表し、qは、0~7の整数を表し、rは、0~2の整数を表し、r1は、0~3の整数を表し、r2は、0~5の整数を表し、r3は、0~7の整数を表し、r4は、0~9の整数を表す。]で表されるフタル酸ジアミド化合物又はその塩。

【0016】 [2] 上記 [1] 記載のフタル酸ジアミド化合物又はその塩の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

【0017】 [3] 上記 [1] 記載のフタル酸ジアミド化合物又はその塩の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。

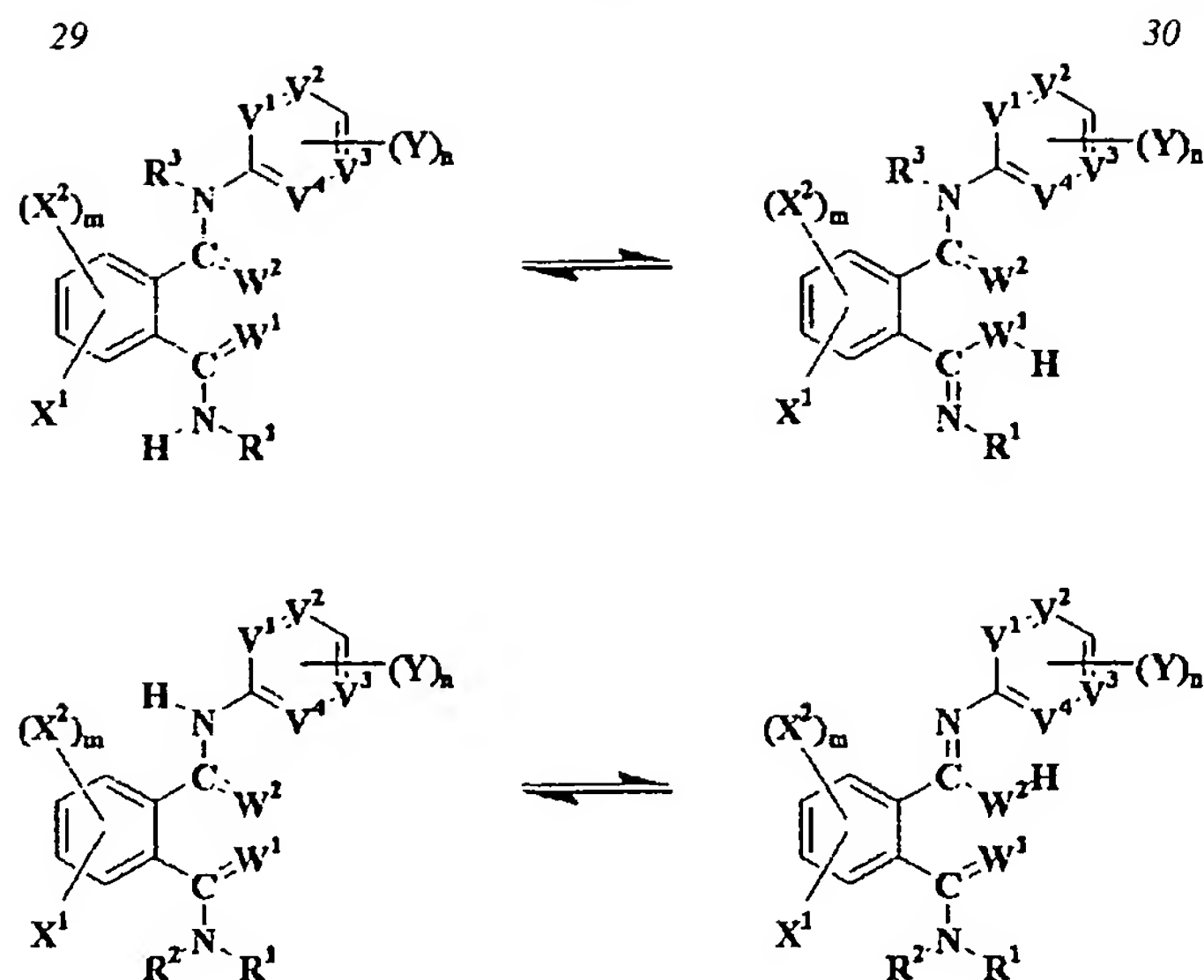
【0018】 [4] 上記 [1] 記載のフタル酸ジアミド化合物又はその塩の1種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫又は殺ダニ剤。

【0019】

【発明の実施の形態】 本発明に包含される化合物には、置換基の種類によってはE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれらE-体、Z-体又はE-体及びZ-体を任意の割合で含む混合物を包含するものである。また、本発明に包含される化合物のうちには、1個又は2個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在する場合があるが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。さらに、本発明化合物はR¹、R²又はR³が水素原子であるときに、場合によっては次式で表される互変異性体の存在が考えられるが、本発明はそれらの構造をも包含するものである。

【0020】

【化11】



【0021】本発明に包含される化合物のうち、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸及び沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、リン酸、塩素酸及び過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸及びp-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒石酸、蔞酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸及びクエン酸等のカルボン酸の塩、グルタミン酸及びアスパラギン酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

【0022】或いは、本発明に包含される化合物のうち、常法に従って金属塩にすることができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩とすることができる。

【0023】次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、n-はノルマル、i-はイソ、s-はセカンダリー及びt-はターシャリーを各々意味する。

【0024】本発明化合物におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

【0025】本明細書におけるC_a~C_bアルキルの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、s-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ネオペンチル、n-ヘキシ

ル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、ヘプチル、1-メチルヘキシル、5-メチルヘキシル、1,1-ジメチルペンチル、2,2-ジメチルペンチル、4,4-ジメチルペンチル、1-エチルペンチル、2-エチルペンチル、1,1,3-トリメチルブチル、1,2,2-トリメチルブチル、1,3,3-トリメチルブチル、2,2,3-トリメチルブチル、2,3,3-トリメチルブチル、1-n-プロピルブチル、1,1,2,2-テトラメチルプロピル、オクチル、1-メチルヘプチル、3-メチルヘプチル、6-メチルヘプチル、2-エチルヘキシル、5,5-ジメチルヘキシル、2,4,4-トリメチルペンチル、1-エチル-1-メチルペンチル、ノニル、1-メチルオクチル、2-メチルオクチル、3-メチルオクチル、7-メチルオクチル、1-エチルヘプチル、1,1-ジメチルヘプチル、6,6-ジメチルヘプチル、デシル、1-メチルノニル、2-メチルノニル、6-メチルノニル、1-エチルオクチル、1-n-プロピルヘプチル、ウンデシル、1-メチルデシル、2-メチルデシル、8-メチルデシル、1-エチルノニル、1-n-プロピルオクチル、1-n-ブチルヘプチル、ドデシル、1-メチルウンデシル、3-メチルウンデシル、9-メチルウンデシル、10-メチルウンデシル、1-エチルデシル、1-n-プロピルノニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0026】本明細書におけるC_a~C_bハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異

なっている。例えばフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモジフルオロメチル、2-フルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、1-プロモエチル、2-プロモエチル、2,2-ジフルオロエチル、1,2-ジクロロエチル、2,2-ジクロロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、1,1,2,2-テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、2-プロモ-2-クロロエチル、2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1,2,2,2-テトラフルオロエチル、2-プロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル、2,2-ジクロロ-1,1,2,2-トリフルオロエチル、1-クロロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、2-プロモプロピル、3-プロモプロピル、2-プロモ-1-メチルエチル、3-ヨードプロピル、2,3-ジクロロプロピル、2,3-ジプロモプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、3,3,3-トリクロロプロピル、3-プロモ-3,3-ジフルオロプロピル、3,3-ジクロロ-3-フルオロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル、1-プロモ-3,3,3-トリフルオロプロピル、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル、2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル、ヘプタフルオロプロピル、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチル、2,3-ジクロロ-1,1,2,3,3-ペンタフルオロプロピル、2-クロロプロピル、3-クロロプロピル、4-クロロプロピル、2-クロロ-1,1-ジメチルエチル、4-プロモプロピル、3-プロモ-2-メチルプロピル、2-プロモ-1,1-ジメチルエチル、2,2-ジクロロ-1,1-ジメチルエチル、2-クロロ-1-クロロメチル-2-メチルエチル、4,4,4-トリフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロ-1-メチルプロピル、3,3,3-トリフルオロ-2-メチルプロピル、2,3,4-トリクロロプロピル、2,2,2-トリクロロ-1,1-ジメチルエチル、4-クロロ-4,4-ジフルオロプロピル、4,4-ジクロロ-4-フルオロプロピル、4-プロモ-4,4-ジフルオロプロピル、2,4-ジプロモ-4,4-ジフルオロプロピル、3,4-ジクロロ-3,4,4-トリフルオロプロピル、3,3-ジクロロ-4,4,4-トリフルオロプロピル、4-プロモ-3,3,4,4-テトラフルオロプロピル、4-プロモ-3-クロロ-3,4,4-トリフルオロプロピル、2,2,3,3,4,4-ヘキサフルオロプロピル、2,2,3,4,4,4-ヘキサフルオロプロピル、2,2,2-トリフルオロ-1-メチル-1-トリフルオロメチルエチル、3,3,3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル、2,2,3,3,4,4,4-ヘプタフルオロプロピル、2,3,3,3-テトラフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル、1,1,2,2,3,3,4,4-オクタフルオロプロピル、ノナフルオロプロピル、4-クロロ-1,1,2,2,3,3,4,4-オクタフルオロプロピル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2,2-ジメチルプロピル、5-プロモペンチル、1,5-ジプロモペンチル、4,4,4-トリフルオロ-2-メチルプロピル、4,4,5,5,5-ペンタフルオロペンチル、5-プロモ-4,4,5,5-テトラフルオロペンチル、4,4-ジクロロ-5,5,5-トリフルオロペンチル、4,5-ジクロロ-4,5,5-

トリフルオロペンチル、5-プロモ-4-クロロ-4,5,5-トリフルオロペンチル、4,4,4-トリフルオロ-4-トリフルオロメチルプロピル、3,3,4,4,5,5,5-ヘプタフルオロペンチル、3,4,4,4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチルプロピル、2,3,3,4,4,4-ヘキサフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル、2,4,5-トリクロロ-1,1,2,3,3,4,5,5-オクタフルオロペンチル、6-クロロヘキシル、6-プロモヘキシル、4,4-ジクロロ-2,2-ジメチルプロピル、4,4,5,5,6,6,6-ヘプタフルオロヘキシル、4,5,5,5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチルペンチル、3,4,4,5,5,5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチルペンチル、4,4,4-トリフルオロ-3,3-ビストリフルオロメチルプロピル、1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-ドデカフルオロヘキシル、トリデカフルオロヘキシル、6-クロロ-1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-ドデカフルオロヘキシル、7-プロモヘプチル、4,5,5,6,6,6-ヘキサフルオロ-4-トリフルオロメチルヘキシル、5,5,5-トリフルオロ-4,4-ビストリフルオロメチルペンチル、ペンタデカフルオロヘプチル、8-クロロオクチル、8-プロモオクチル、7,7,8,8,8-ペンタフルオロオクチル、9-プロモノニル、9,9,9-トリフルオロノニル、7,8,8,8-テトラフルオロ-7-トリフルオロメチルオクチル、10-クロロデシル、10-プロモデシル、11-プロモウンデシル、11,11,11-トリフルオロウンデシル、12-プロモドデシル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0027】本明細書におけるC_a~C_bシクロアルキルの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていても良い。例えばシクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、2,2-ジメチルシクロプロピル、2,2,3,3-テトラメチルシクロプロピル、シクロブチル、2,3,4-トリメチルシクロブチル、シクロペンチル、1-メチルシクロペンチル、2-メチルシクロペンチル、3-メチルシクロペンチル、1-エチルシクロペンチル、2-エチルシクロペンチル、3-エチルシクロペンチル、1-n-プロピルシクロペンチル、1,2-ジメチルシクロペンチル、1,3-ジメチルシクロペンチル、2,2-ジメチルシクロペンチル、2,3-ジメチルシクロペンチル、2,4-ジメチルシクロペンチル、2,5-ジメチルシクロペンチル、3,4-ジメチルシクロペンチル、2,2,4-トリメチルシクロペンチル、2,3,4-トリメチルシクロペンチル、2,4,4-トリメチルシクロペンチル、シクロヘキシル、1-メチルシクロヘキシル、2-メチルシクロヘキシル、3-メチルシクロヘキシル、4-メチルシクロヘキシル、1-エチルシクロヘキシル、2-エチルシクロヘキシル、4-エチルシクロヘキシル、2,3-ジメチルシクロヘキシル、2,4-ジメチルシクロヘキシル、2,5-ジメチルシクロヘキシル、2,6-ジメチルシクロヘキシル、3,3-ジメチルシクロヘキシル、3,

4-ジメチルシクロヘキシル、3,5-ジメチルシクロヘキシル、4,4-ジメチルシクロヘキシル、シス-ビスシクロ[3.1.0]ヘキサン-2-イル、ビスシクロ[2.1.1]ヘキサン-5-イル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0028】本明細書におけるC_a~C_bハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているとしても良く、また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていても良い。さらに、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよい。例えば1-ブロモシクロプロピル、2,2-ジクロロシクロプロピル、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル、2,2-ジクロロ-3,3-ジメチルシクロプロピル、1-ブロモシクロブチル、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル、3,4-ジブロモシクロペンチル、1-ブロモシクロヘキシル、2-フルオロシクロヘキシル、2-クロロシクロヘキシル、3-クロロシクロヘキシル、4-クロロシクロヘキシル、2,2,6,6-テトラクロロシクロヘキシル、1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-ウンデカフルオロシクロヘキシル、2-トリフルオロメチルシクロヘキシル、3-トリフルオロメチルシクロヘキシル、4-トリフルオロメチルシクロヘキシル、2-トリクロロメチルシクロヘキシル、3,5-ジトリフルオロメチルシクロヘキシル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0029】本明細書におけるC_a~C_bアルケニルの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル、1-プロペニル、i-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、3-ブテニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,3-ブタジエニル、1-ペンテニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、3-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、4-ペンテニル、1-メチル-3-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,3-ペンタジエニル、1-ビニル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、1-プロピル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、1-エチル-2-ブテニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-4-ペンテニル、1-エチル-3-ブテニル、1-(i-ブチ

ル)ビニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル、1-(i-プロピル)-2-プロペニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1,5-ヘキサジエニル、1-ビニル-3-ブテニル、2,4-ヘキサジエニル、1-ヘブテニル、1-ブチル-2-プロペニル、2-ヘブテニル、3-ヘブテニル、4-ヘブテニル、5-ヘブテニル、6-ヘブテニル、1-エチル-4-ペンテニル、3-メチル-1-ヘキセニル、1-(i-プロピル)-2-ブテニル、1-(i-プロピル)-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ペンテニル、1,1-ジメチル-4-ペンテニル、1,3-ジメチル-4-ペンテニル、1,4-ジメチル-4-ペンテニル、1-エチル-1-メチル-3-ブテニル、1-エチル-3-メチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ペンテニル、2,2-ジメチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-3-ブテニル、1,1,3-トリメチル-3-ブテニル、2,2,3-トリメチル-3-ブテニル、2,4-ヘプタジエニル、3-メチル-1-ビニル-3-ブテニル、1,3,5-ヘプタトリエニル、1-オクテニル、1-ペンチル-2-プロペニル、2-オクテニル、3-オクテニル、1-メチル-2-ヘブテニル、5-オクテニル、7-オクテニル、1-エチル-2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-5-ヘブテニル、1,5-ジメチル-4-ヘキセニル、1,5-ジメチル-5-ヘキセニル、2-エチル-2-ヘキセニル、1-(i-プロピル)-3-メチル-3-ブテニル、1-エチル-1,2-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-1,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3,4-トリメチル-4-ペンテニル、2-ネオペンチル-2-プロペニル、2,4-オクタジエニル、2,7-オクタジエニル、1-(2-メチル-2-プロペニル)-2-ブテニル、1-(i-プロペニル)-4-ペンテニル、1-(i-プロペニル)-3-メチル-3-ブテニル、1,1,4-トリメチル-2,4-ペンタジエニル、5-メチル-2-メチレン-5-ヘキセニル、1-ノネニル、1-(n-ヘキシル)-2-プロペニル、2-ノネニル、1-メチル-1-オクテニル、3-ノネニル、6-ノネニル、8-ノネニル、7-メチル-5-オクテニル、2,6-ジメチル-5-ヘブテニル、1,1,5-トリメチル-4-ヘキセニル、4,4,5-トリメチル-5-ヘキセニル、3-(ネオペンチル)-3-ブテニル、2,4-ノナジエニル、2,6-ノナジエニル、3,6-ノナジエニル、2,6-ジメチル-1,5-ヘプタジエニル、2,4-ジメチル-2,6-ヘプタジエニル、1,4-ジメチル-1,3,5-ヘプタトリエニル、1,3-ジメチル-1,4,6-ヘプタトリエニル、1-デセニル、4-デセニル、5-デセニル、7-デセニル、9-デセニル、1,2-ジメチル-1-オクテニル、3,7-ジメチル-6-オクテニル、1-エチル-1,5-ジメチル-4-ヘキセニル、3,7-ジメチル-7-オクテニル、1,1,5-トリメチル-6-ヘブテニル、5-エチル-1,1-ジメチル-5-ヘキセニル、1-エチル-3,3,4-トリメチル-4-ペンテニル、2-(i-プロピル)-5-メチル-4-ヘキセニル、2-アリル-5-メチル-4-ヘキセニル、1,1,4-トリメチル-2-ビニル-

3-ペンテニル、1-メチレン-3-ノネニル、2,4-デカジエニル、1-メチル-1,3-ノナジエニル、5,9-デカジエニル、1,5-ジメチル-1-ビニル-4-ヘキセニル、3,7-ジメチル-2,6-オクタジエニル、1-エチル-1,5-ジメチル-2,4-ヘキサジエニル、1-(i-プロペニル)-4-メチル-3,5-ヘキサジエニル、1-ウンデセニル、2-ウンデセニル、4-ウンデセニル、10-ウンデセニル、1,3,7-トリメチル-6-オクテニル、2,4-ウンデカジエニル、5,10-ウンデカジエニル、2,5,8-ウンデカトリエニル、1-ドデセニル、2-ドデセニル、5-ドデセニル、7-ドデセニル、8-ドデセニル、9-ドデセニル、10-ドデセニル、11-ドデセニル、1-エチル-3,7-ジメチル-6-オクテニル、1-エチル-3,7-ジメチル-7-オクテニル、2,4-ドデカジエニル、5,7-ドデカジエニル、8,10-ドデカジエニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0030】本明細書におけるC_a~C_bハロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、例えば2-クロロビニル、2-ブロモビニル、2-ヨードビニル、2,2-ジクロロビニル、2,2-ジブロモビニル、3-ブロモ-2-プロペニル、1-クロロメチルビニル、2-ブロモ-1-メチルビニル、1-トリフルオロメチルビニル、3,3,3-トリクロロ-1-プロペニル、3-ブロモ-3,3-ジフルオロ-1-プロペニル、2-クロロ-3,3,3-トリクロロ-1-プロペニル、2,3,3,3-テトラクロロ-1-プロペニル、1-トリフルオロメチル-2,2-ジフルオロビニル、2-クロロ-2-プロペニル、2,3,3-トリクロロ-2-プロペニル、4-ブロモ-3-クロロ-3,4,4-トリフルオロ-1-ブテニル、1-ブロモメチル-2-プロペニル、3-クロロ-2-ブテニル、4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル、4-ブロモ-4,4-ジフルオロ-2-ブテニル、3-ブロモ-3-ブテニル、3,4,4-トリフルオロ-3-ブテニル、3,4,4-トリブロモ-3-ブテニル、3-ブロモ-2-メチル-2-プロペニル、3,3,3-トリフルオロ-2-メチルプロペニル、3-クロロ-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル、3,3,3-トリフルオロ-1-メチル-1-プロペニル、3,4,4-トリフルオロ-1,3-ブタジエニル、3,4-ジブロモ-1-ペンテニル、3,3,4,4,5,5,5-ヘプタフルオロ-1-ペンテニル、5,5-ジフルオロ-4-ペンテニル、4,5,5-トリフルオロ-4-ペンテニル、3,4,4,4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ブテニル、3,5,5-トリフルオロ-2,4-ペンタジエニル、4,4,5,5,6,6,6-ヘプタフルオロ-2-ヘキセニル、3,4,4,5,5,5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ペンテニル、4,5,5,5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル、5-ブロモ-4,5,5-トリフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル、4,5,5,6,6,6-ヘキサフルオロ-4-トリフルオロ

メチル-2-ヘキセニル、3-パーフルオロブチル-2-プロペニル、3-ヨード-2-オクテニル、2-パーフルオロヘキシルビニル、3-パーフルオロヘキシル-2-プロペニル、12-ブロモ-2-ドデセニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0031】本明細書におけるC_a~C_bアルキニルの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-ペンチニル、1-エチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ヘキシニル、1-(n-プロピル)-2-プロピニル、2-ヘキシニル、1-エチル-2-ブチニル、3-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、5-ヘキシニル、1-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル、1-(i-プロピル)-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-ヘプチニル、1-(n-ブチル)-2-プロピニル、2-ヘプチニル、3-ヘプチニル、1-メチル-3-ヘキシニル、1-エチル-2-ペンチニル、1-エチル-3-ペンチニル、6-ヘプチニル、1-メチル-1-(n-プロピル)-2-プロピニル、1-(i-プロピル)-1-メチル-2-プロピニル、1-(i-ブチル)-2-プロピニル、5-メチル-3-ヘキシニル、1,1-ジメチル-2-ペンチニル、1-エチル-1-メチル-2-ブチニル、1-オクチニル、1-(n-ペンチル)-2-プロピニル、2-オクチニル、3-オクチニル、1-メチル-3-ヘプチニル、1-エチル-3-ヘキシニル、7-オクチニル、1-(n-ブチル)-1-メチル-2-プロピニル、1-(1-メチルブチル)-2-プロピニル、1-(i-ブチル)-1-メチル-2-プロピニル、2-ノニニル、3-ノニニル、1-エチル-3-ヘプチニル、1-メチル-1-(n-ペンチル)-2-プロピニル、1-(n-ブチル)-1-メチル-2-ブチニル、1-(n-ブチル)-1-エチル-2-プロピニル、1-(i-ペンチル)-1-メチル-2-プロピニル、1-デシニル、2-デシニル、3-デシニル、5-デシニル、9-デシニル、1-(n-ヘキシル)-1-メチル-2-プロピニル、2-ウンデシニル、10-ウンデシニル、5,10-ウンデカジエニル、3-ドデシニル、7-ドデシニル、9-ドデシニル、10-ドデシニル、11-ドデシニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0032】本明細書におけるC_a~C_bハロアルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、例えば2-クロロエチニル、2-ブロモエチニル、2-ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロ

ピニル、3-プロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、3,3,3-トリフルオロ-1-プロピニル、3-クロロ-1-メチル-2-プロピニル、3-プロモ-1-メチル-2-プロピニル、3-ヨード-1-メチル-2-プロピニル、3-クロロ-1,1-ジメチル-2-プロピニル、3-プロモ-1,1-ジメチル-2-プロピニル、3-ヨード-1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-クロロメチル-1-メチル-2-ブチニル、4-クロロ-2,2-ジメチル-3-ブチニル、4-プロモ-2,2-ジメチル-3-ブチニル、4-ヨード-2,2-ジメチル-3-ブチニル、10-プロモ-9-デシニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0033】本明細書におけるC_a~C_bシクロアルケニルの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる環状の、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていても良く、このとき二重結合は環内又は置換基のどちらに存在していても良い。例えば2-ビニルシクロプロピル、3,3-ジメチル-2-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロピル、シクロペンテン-1-イル、2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、3-メチレンシクロペンチル、2-アリルシクロペンチル、シクロヘキセン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル、4-メチレンシクロヘキシル、3-メチル-2-シクロヘキセン-1-イル、2-メチル-2-シクロヘキセン-1-イル、1-メチル-2-シクロヘキセン-1-イル、4-メチル-3-シクロヘキセン-1-イル、1-メチル-3-シクロヘキセン-1-イル、6-メチル-3-シクロヘキセン-1-イル、6-メチル-2-メチレンシクロヘキシル、2-エチル-3-シクロヘキセン-1-イル、4,6-ジメチル-3-シクロヘキセン-1-イル、2-メチル-2,5-シクロヘキサジエン-1-イル、ビスクロ[2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル、2-メチルビスクロ[2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0034】本明細書におけるC_a~C_bハロシクロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる環状の、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていても良く、このとき二重結合は環内又は置換基のどちらに存在していても良い。さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっても良い。例えば2-(2,2-ジクロロピニル)-3,3-ジメチルシクロプロピル、2-(2-クロロ-3,3-トリフルオロ-1-プロペニル)-3,3-ジメチルシクロプロピル、2-クロロビスクロ[2.2.1]-5-ヘプテン-2-イル

等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0035】本明細書におけるC_a~C_bアルコキシの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-O-基を表し、例えばメトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、i-プロピルオキシ、n-ブチルオキシ、s-ブチルオキシ、i-ブチルオキシ、t-ブチルオキシ、n-ペンチルオキシ、1-メチルブチルオキシ、2-メチルブチルオキシ、3-メチルブチルオキシ、1-エチルプロピルオキシ、1,1-ジメチルプロピルオキシ、1,2-ジメチルプロピルオキシ、ネオペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルブチルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0036】本明細書におけるC_a~C_bハロアルコキシの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-O-基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっても良い。例えばジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-1,1,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロ-1,1-ジフルオロエトキシ、2-プロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、2-クロロプロピルオキシ、3-クロロプロピルオキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエトキシ、2,2,3,3-テトラフルオロプロピルオキシ、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルオキシ、2-プロモ-1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルオキシ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0037】本明細書におけるC_a~C_bアルキルチオの表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S-基を表し、例えばメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、s-ブチルチオ、i-ブチルチオ、t-ブチルチオ、n-ペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、1-エチルプロピルチオ、1,1-ジメチルプロピルチオ、1,2-ジメチルプロピルチオ、ネオペンチルチオ、n-ヘキシルチオ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0038】本明細書におけるC_a~C_bハロアルキルチオの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S-基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっても良い。例えばジフルオロメチルチ

オ、トリフルオロメチルチオ、ブロモジフルオロメチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、1,1,2-トリフルオロ-2-クロロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、2-ブロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、ヘプタフルオロプロピルチオ、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチルチオ、ノナフルオロブチルチオ等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0039】本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(0)-基を表し、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0040】本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(0)-基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えばジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、ブロモジフルオロメチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、2-ブロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフィニル、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチルスルフィニル、ノナフルオロブチルスルフィニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0041】本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(0)₂-基を表し、例えばメタンスルホニル、エタンスルホニル、 n -プロパンスルホニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0042】本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(0)₂-基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えばジフルオロメタンスルホニル、トリフルオロメタンスルホニル、2,2,2-トリフルオロエタンスルホニル、1,1,2,2-テトラフルオロエタンスルホニル、1,1,2-トリフルオロ-2-クロロエタンスルホニル等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0043】本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状アルキル-C(0)-基を表し、例えば $CH_3C(0)-$ 、 $C_2H_5C(0)-$ 、 $n-C_3H_7C(0)-$ 、 $(CH_3)_2CHC(0)-$ 、 $C_2H_5CH(CH_3)C(0)-$

、 $(CH_3)_2CHCH_2C(0)-$ 、 $t-C_4H_9C(0)-$ 、 $n-C_6H_{13}C(0)-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0044】本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状アルキル-C(0)-基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えば $ClCH_2C(0)-$ 、 $Cl_2CHC(0)-$ 、 $CCl_3C(0)-$ 、 $CF_3C(0)-$ 、 $C_2F_5C(0)-$ 、 $n-C_3F_7C(0)-$ 、 $ClCH_2CH_2CH_2C(0)-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0045】本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状アルキル-O-C(0)-基を表し、例えば $CH_3OC(0)-$ 、 $C_2H_5OC(0)-$ 、 $n-C_3H_7OC(0)-$ 、 $(CH_3)_2CHOC(0)-$ 、 $n-C_4H_9OC(0)-$ 、 $(CH_3)_2CHCH_2OC(0)-$ 、 $t-C_4H_9OC(0)-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0046】本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状アルキル-O-C(0)-基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えば $ClCH_2CH_2OC(0)-$ 、 $CF_3CH_2OC(0)-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0047】本明細書における $C_a \sim C_b$ シアノアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、シアノによって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基を表し、例えば $NCCH_2-$ 、 $NCCH_2CH_2-$ 、 $CH_3CH(CN)-$ 、 $NCCH_2CH_2CH_2-$ 、 $NCC(CH_3)_2-$ 、 $NC(CH_2)_4-$ 、 $NCCH_2C(CH_3)_2-$ 、 $NCC(CH_3)(C_2H_5)-$ 、 $NCC(C_2H_5)_2-$ 、 $NC(CH_2)_6-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0048】本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-NH-基を表し、例えば CH_3NH- 、 C_2H_5NH- 、 $n-C_3H_7NH-$ 、 $i-C_3H_7NH-$ 、 $n-C_4H_9NH-$ 、 $i-C_4H_9NH-$ 、 $t-C_4H_9NH-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0049】本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノの表記は、窒素原子に結合した水素原子が、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基によって、ふたつとも置換された>N-基を表し、このとき、それらのアルキル基は互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えば $(CH_3)_2N-$ 、 $C_2H_5N(CH_3)-$ 、 $(C_2H_5)_2N-$ 、 $n-C_3H_7N(CH_3)-$ 、 $i-C_3H_7N(CH_3)-$ 、 $(n-C_3H_7)_2N-$ 等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

7)2N-, n-C₄H₉N(CH₃)-、i-C₄H₉N(CH₃)-、t-C₄H₉N(CH₃)-等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0050】本明細書におけるC_a~C_bアルキルアミノカルボニルの表記は、窒素原子に結合した水素原子が、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基によって置換された-NH-C(O)-基を表し、例えばCH₃NHC(O)-、C₂H₅NHC(O)-、n-C₃H₇NHC(O)-、i-C₃H₇NHC(O)-、n-C₄H₉NHC(O)-、i-C₄H₉NHC(O)-、t-C₄H₉NHC(O)-等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0051】本明細書におけるジ(C_a~C_b)アルキルアミノカルボニルの表記は、窒素原子に結合した水素原子が、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基によって、ふたつとも置換された>N-C(O)-基を表し、このとき、それらのアルキルは互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えば(CH₃)₂NC(O)-、C₂H₅N(CH₃)C(O)-、(C₂H₅)₂NC(O)-等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0052】本明細書におけるC_a~C_bアルキルアミノチオカルボニルの表記は、窒素原子に結合した水素原子が、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基によって置換された-NH-C(S)-基を表し、例えばCH₃NHC(S)-、C₂H₅NHC(S)-、n-C₃H₇NHC(S)-、i-C₃H₇NHC(S)-、n-C₄H₉NHC(S)-、i-C₄H₉NHC(S)-、t-C₄H₉NHC(S)-等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0053】本明細書におけるジ(C_a~C_b)アルキルアミノチオカルボニルの表記は、窒素原子に結合した水素原子が、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基によって、ふたつとも置換された>N-C(S)-基を表し、このとき、それらのアルキルは互いに同一でも、又は互いに相異なっているても良い。例えば(CH₃)₂NC(S)-、C₂H₅N(CH₃)C(S)-、(C₂H₅)₂NC(S)-等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0054】本明細書における(Z)_pによって置換されていてもよいベンジルの表記は、互いに同一でも、または相異なっているてもよいZが、ベンゼン環を形成する炭素原子に結合したベンジル基を表す。

【0055】本明細書におけるC_a~C_bシクロアルキル(C_d~C_e)アルキル、C_a~C_bアルコキシ(C_d~C_e)アルキル、C_a~C_bアルキルチオ(C_d~C_e)アルキル、C_a~C_bアルコキシカルボニル(C_d~C_e)アルキル又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C_d~C_e)アルキル等の表記は、それぞれ上記の意味である任意のC_a~C_bシクロアルキル基、C_a~C_bアルコキシ基、C_a~C_bアルキルチオ基、C_a~C_bアルコキシカルボニル基、C_a~C_bハ

ロアルコキシカルボニル基又は(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数がd~e個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0056】本明細書におけるR⁵によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキル、R¹⁶によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキル、R²⁸によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキル、R³²によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキル又はR³⁵によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、任意のR⁵基、R¹⁶基、R²⁸基、R³²基又はR³⁵基によって任意に置換された、炭素原子数がd~e個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、ここでそれぞれの(C_d~C_e)アルキル上の置換基R⁵、R¹⁶、R²⁸、R³²又はR³⁵が2個以上存在するとき、それぞれのR⁵、R¹⁶、R²⁸、R³²又はR³⁵は互いに同一でも、または相異なっているてもよい。

【0057】本明細書におけるR⁵によって任意に置換された(C_d~C_e)アルケニル、R¹⁶によって任意に置換された(C_d~C_e)アルケニル、R²⁸によって任意に置換された(C_d~C_e)アルケニル、R³²によって任意に置換された(C_d~C_e)アルケニル又はR³⁵によって任意に置換された(C_d~C_e)アルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、任意のR⁵基、R¹⁶基、R²⁸基、R³²基又はR³⁵基によって任意に置換された、炭素原子数がd~e個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、ここでそれぞれの(C_d~C_e)アルケニル上の置換基R⁵、R¹⁶、R²⁸、R³²又はR³⁵が2個以上存在するとき、それぞれのR⁵、R¹⁶、R²⁸、R³²又はR³⁵は互いに同一でも、または相異なっているてもよい。

【0058】本明細書におけるR⁵によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキニル、R¹⁶によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキニル、R²⁸によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキニル、R³²によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキニル又はR³⁵によって任意に置換された(C_d~C_e)アルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、任意のR⁵基、R¹⁶基、R²⁸基、R³²基又はR³⁵基によって任意に置換された、炭素原子数がd~e個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、ここでそれぞれの(C_d~C_e)アルキニル上の置換基R⁵、R¹⁶、R²⁸、R³²又はR³⁵が2個以上存在するとき、それぞれのR⁵、R¹⁶、R²⁸、R³²又はR³⁵は互いに同一でも、または相異なっているてもよい。

【0059】本明細書における(Z)_pによって置換されていてもよいフェニルによって置換された(C_d~C_e)アルコキシカルボニルの表記は、(Z)_pによって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された上記の意味である(C_d~C_e)アルコ

キシカルボニル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

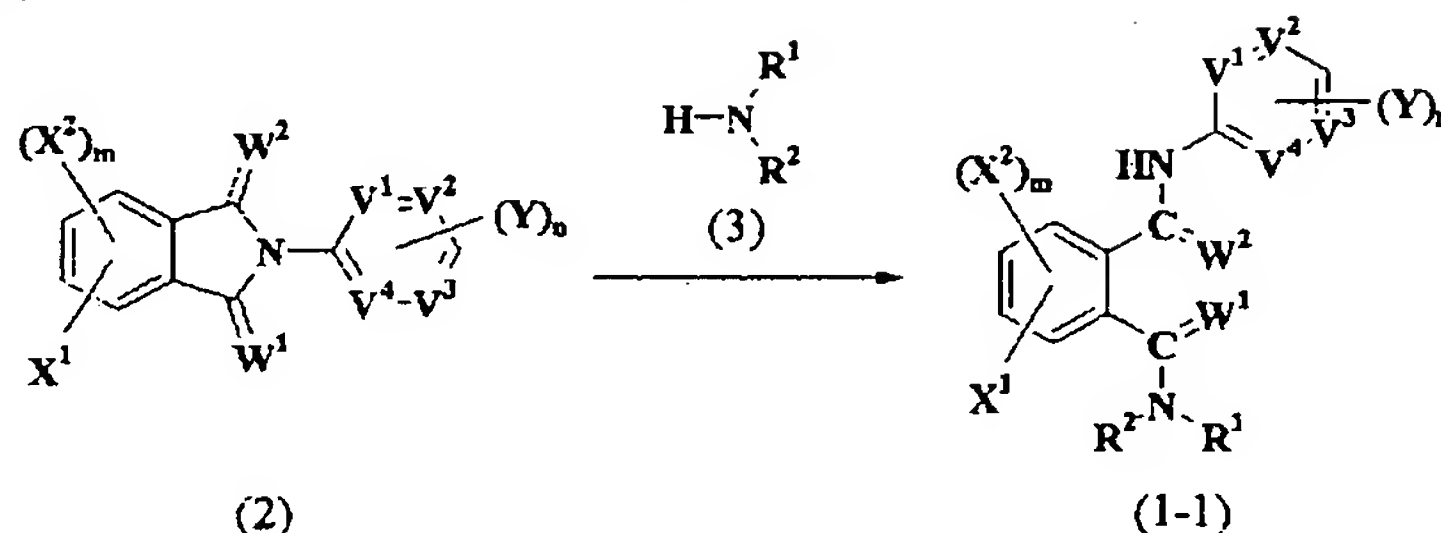
【0060】本発明化合物は、例えば以下の方法により製造することが出来る。

*製造法A

【0061】

【化12】

*



【0062】一般式(2)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^1 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式(3)〔式中、 R^1 及び R^2 は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物とを該反応に対して不活性な溶媒中、又は無溶媒にて、必要ならば触媒の存在下、反応させることにより、一般式

(1)において R^3 が水素原子である一般式(1-1)

〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^1 , X^2 , Y , R^1 , R^2 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

【0063】反応基質の量は、一般式(2)の化合物1当量に対して1~50当量の一般式(3)の化合物を用いることができる。

【0064】溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン

等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

【0065】触媒を用いる場合、反応の触媒としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸等の鉱酸類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸、トリエチルアミン塩酸塩、ピリジン塩酸塩等のアミン類の酸付加塩、塩化亜鉛、四塩化チタン、塩化セリウム、イッテルビウムトリフレート、三フッ化ホウ素-エーテル錯体等のルイス酸を、一般式(2)の化合物に対して0.001~1当量用いることができる。

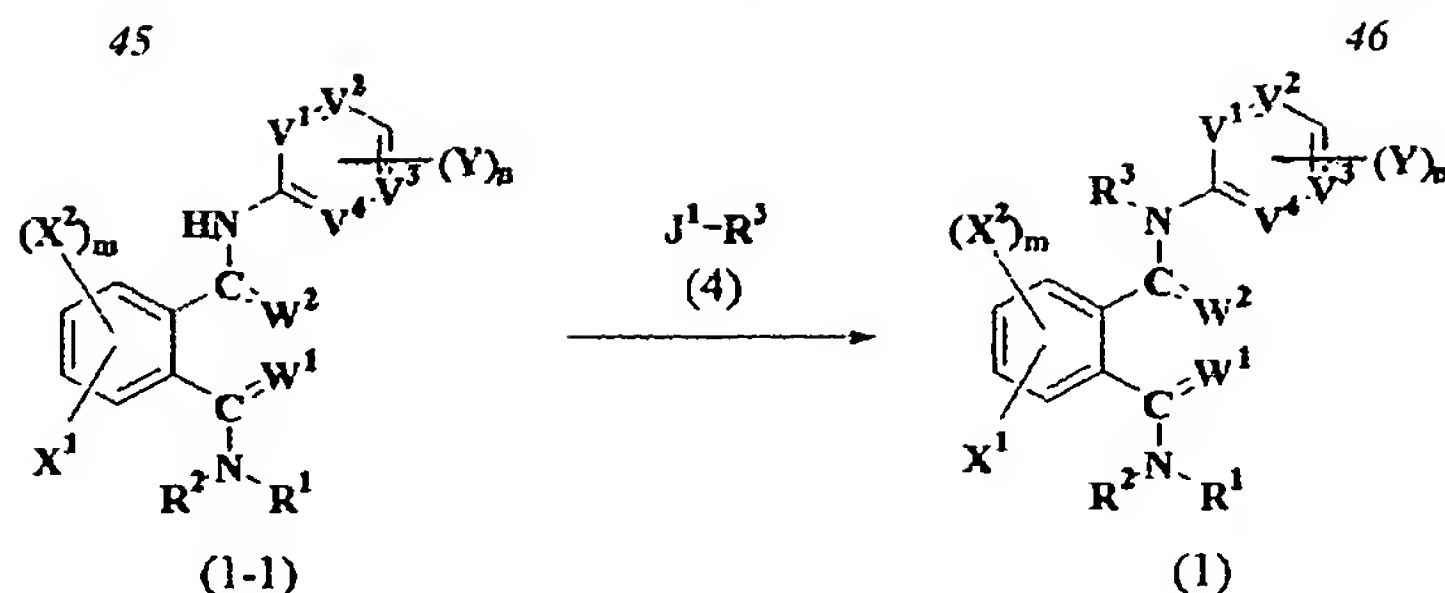
【0066】反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

【0067】一般的には、例えば一般式(2)の化合物1当量に対して1~10当量の一般式(3)の化合物を用い、無溶媒か、又はテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、50℃から反応混合物の還流温度の温度範囲で、30分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法B

【0068】

【化13】



【0069】一般式(1)においてR³が水素原子である一般式(1-1)〔式中、V¹, V², V³, V⁴, W¹, W², X¹, X², Y, R¹, R², m及びnは前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物と、一般式(4)〔式中、R³は水素原子以外の前記と同じ意味を表し、J¹は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C₁~C₄アルキルカルボニルオキシ(例えば、ピバロイルオキシ)、C₁~C₄アルキルスルホネート(例えば、メタンスルホニルオキシ)、C₁~C₄ハロアルキルスルホネート(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ)、アリールスルホネート(例えば、ベンゼンスルホニルオキシ、p-トルエンスルホニルオキシ)又はアゾリル(例えば、イミダゾール-1-イル)のような良好な脱離基を表す。〕で表される化合物とを、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(1)〔式中、V¹, V², V³, V⁴, W¹, W², X¹, X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表す。〕においてR³が水素原子以外の置換基である本発明化合物を得ることができる。

【0070】反応基質の量は、一般式(1-1)の化合物1当量に対して1~50当量の一般式(4)の化合物を用いることができる。

【0071】溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、

ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

【0072】塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、ターシャリーブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(1-1)の化合物に対して1~4当量用いることができる。

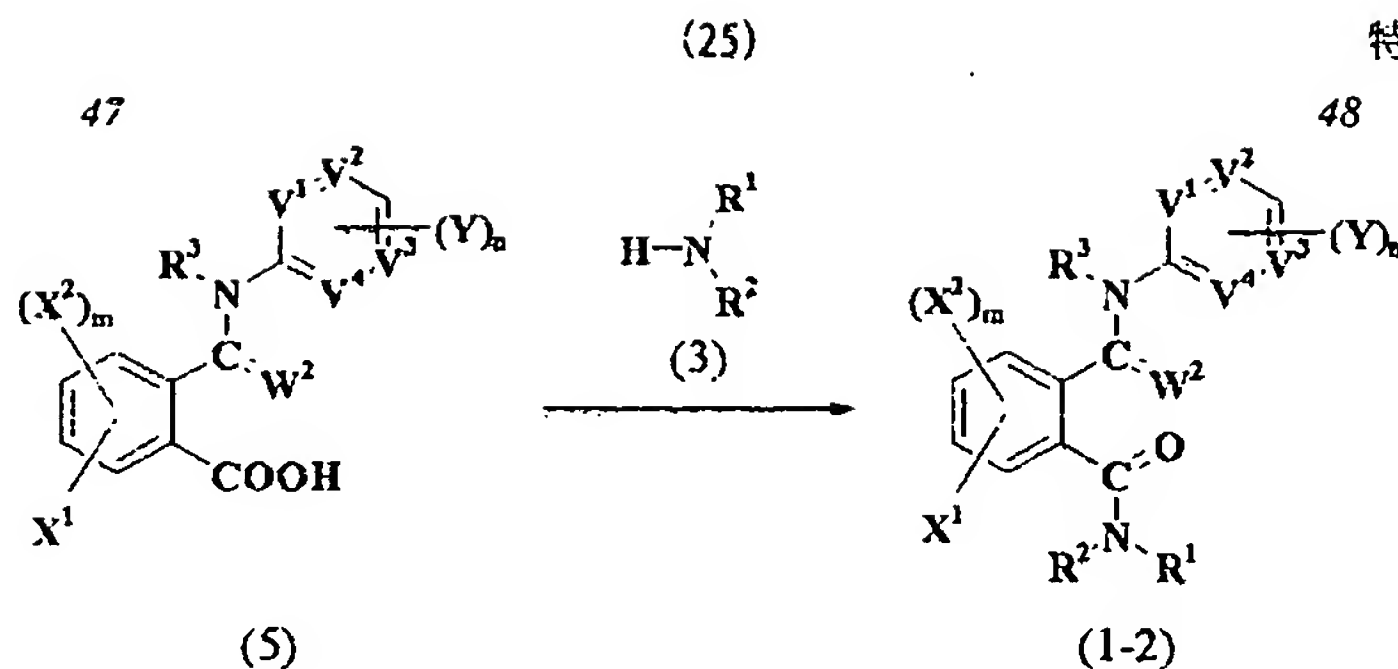
【0073】反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

【0074】一般的には、例えば一般式(1-1)の化合物1当量に対して1~10当量の一般式(4)の化合物を用い、テトラヒドロフランやジメチルホルムアミド等の極性溶媒中、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウムターシャリーブトキシド、水酸化カリウム等を一般式(1-1)の化合物1当量に対して1~3当量用いて、0~90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法C

【0075】

【化14】



【0076】一般式(5)〔式中、 $V^1, V^2, V^3, V^4, W^2, X^1, X^2, Y, R^3, m$ 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式(3)〔式中、 R^1 及び R^2 は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物とを該反応に対して不活性な溶媒中、又は無溶媒にて、必要ならば塩基の存在下、縮合剤を用いて反応させることにより、一般式(1)において W^1 が酸素原子である一般式(1-2)〔式中、 $V^1, V^2, V^3, V^4, W^2, X^1, X^2, Y, R^1, R^2, R^3, m$ 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

【0077】反応基質の量は、一般式(5)の化合物1当量に対して1～100当量の一般式(3)の化合物を用いることができる。

【0078】縮合剤は、通常のアミド合成に使用されるものであれば特に制限はないが、例えば向山試薬(2-クロロ-N-メチルピリジニウム アイオダイド)、DCC(1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド)、WSC(1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド 塩酸塩)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、ジメチルプロピニルスルホニウム プロマイド、プロパルギルトリフェニルホスホニウム プロマイド、DEPC(シアノ磷酸ジエチル)等を、一般式(5)の化合物に対して1～4当量用いることができる。

【0079】溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホ

10 ルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、アセトニトリル及びジメチルスルホキシド等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

【0080】塩基の添加は必ずしも必要ではないが、塩基を用いる場合、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(5)の化合物に対して1～4当量用いることができる。

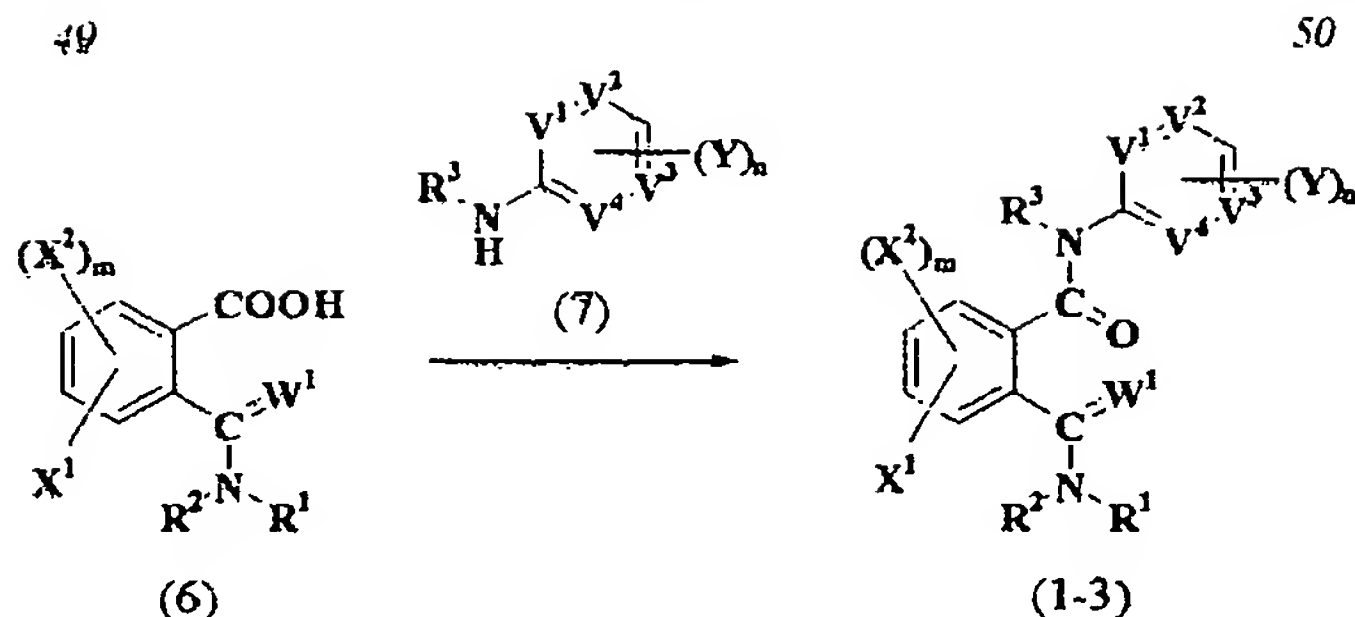
【0081】反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

30 【0082】一般的には、例えば一般式(5)の化合物1当量に対して1～20当量の一般式(3)の化合物及び1～4当量のWSC(1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド 塩酸塩)、CDI(カルボニルジイミダゾール)等の縮合剤を用い、必要ならば1～4当量の炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基存在下にて、無溶媒か、又はジクロロメタン、クロロホルム、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、0℃からこれらの溶媒の還流温度の範囲で、10分

製造法D

【0083】

【化15】



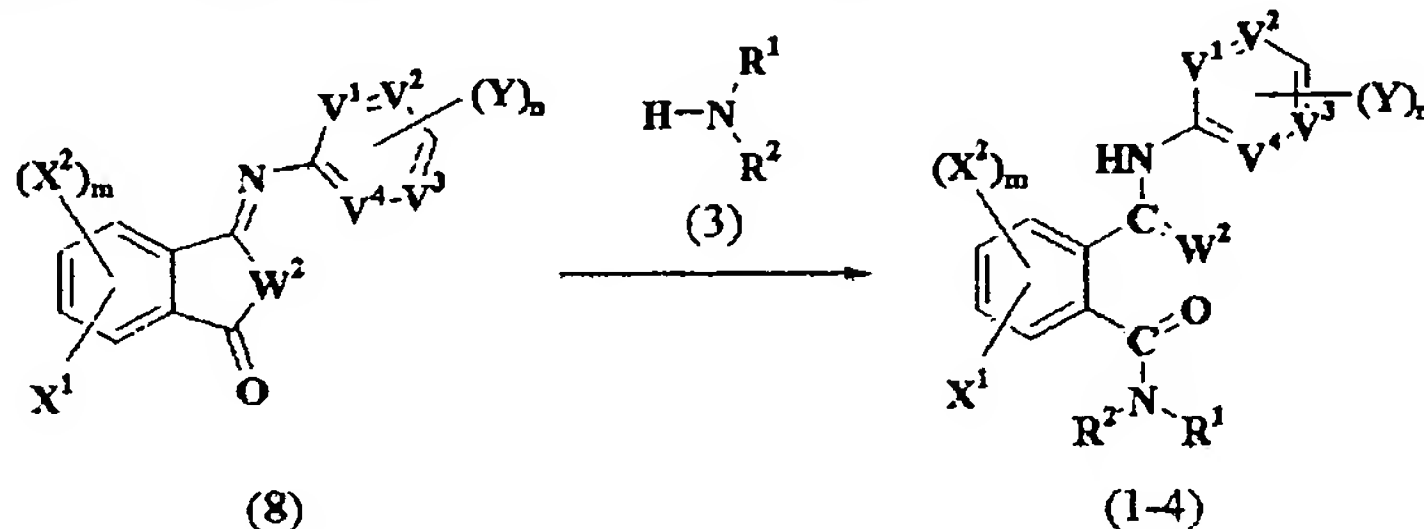
【0084】一般式(6)〔式中、 X^1 , X^2 , W^1 , R^1 , R^2 及び m は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式(7)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , Y , R^3 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物とを、製造法Cと同様な条件下反応させることにより、一般式(1)において W^2 が酸素原子である一般式(1-3) *

10 * 〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , X^1 , X^2 , Y , R^1 , R^2 , R^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法E

【0085】

【化16】



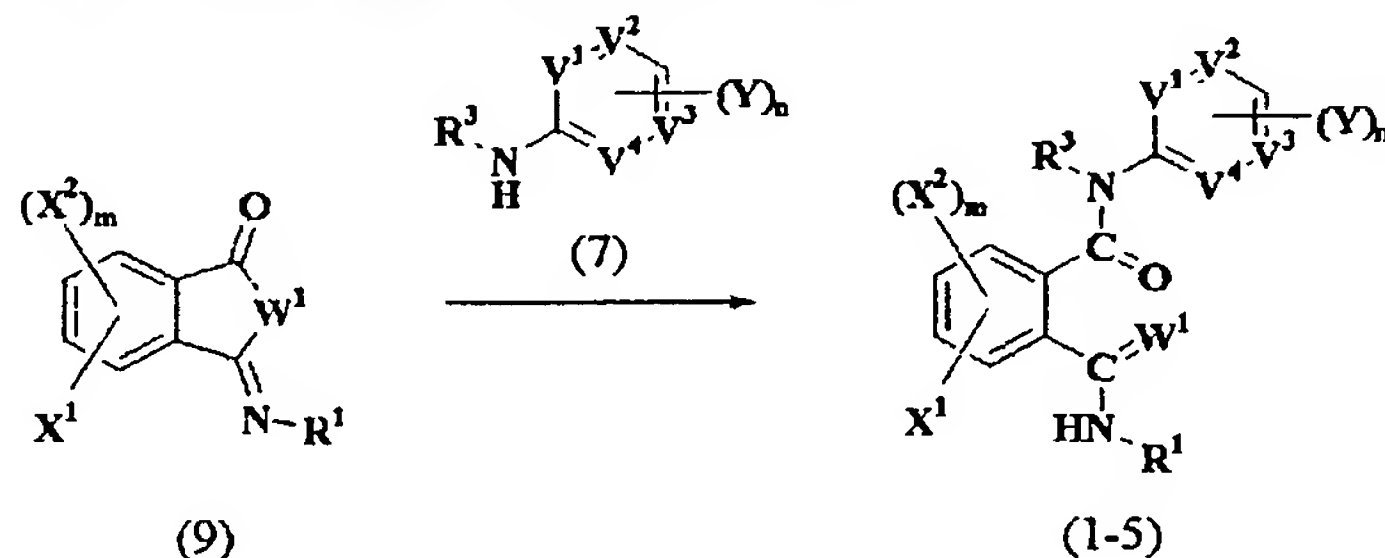
【0086】一般式(8)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^2 , X^1 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式(3)〔式中、 R^1 及び R^2 は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物とを、製造法Aと同様な条件下反応させることにより、一般式(1)において W^1 が酸素原子であり、且つ R^3 が水素原子である※30

※一般式(1-4)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^2 , X^1 , X^2 , Y , R^1 , R^2 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法F

【0087】

【化17】



【0088】一般式(9)〔式中、 W^1 , X^1 , X^2 , R^1 及び m は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物と、一般式(7)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , Y , R^3 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物とを、製造法Aと同様な条件下反応させることにより、一般式(1)において W^2 が酸素原子であり、且つ R^3 が水素原子である一般式(1-5)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , X^1 , X^2 , Y , R^1 , R^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

【0089】製法A~製法Fにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解し、水洗後濃

縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行ない、目的の本発明化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

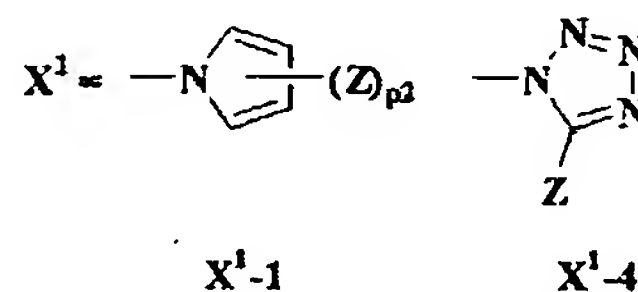
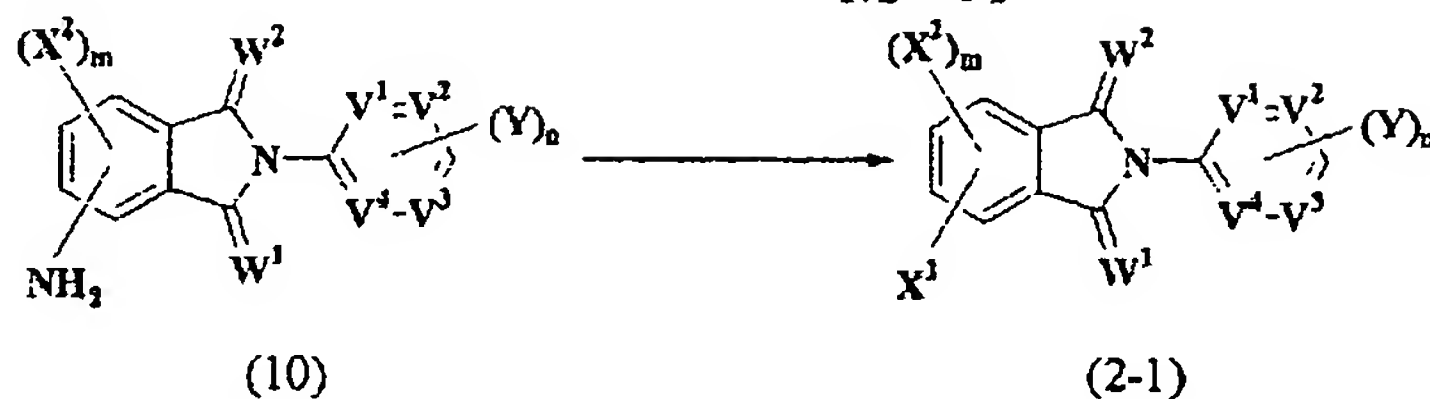
【0090】製造法Aにおいて、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(2)で表される化合物は、以下の方法を用いて合成することができる。

【0091】(a). 一般式(2)において X^1 が X^1-1 又は X^1-4 である一般式(2-1)〔式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W

¹, W², X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物の製造。

*【0092】

*【化18】



【0093】一般式(10) [式中、V¹, V², V³, V⁴, W¹, W², X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.]1947年、69巻、1946頁、ケミストリー・レターズ[Chem. Lett.]1974年、701頁、ジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー[J. Heterocyclic Chem.]1988年、25巻、1003頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式(2-1)で表される化合物において、X¹がX¹-1である化合物を得ることができる。

【0094】また、一般式(10)で表される化合物を、例えばケミッシュェ・ベリヒテ[Chem. Ber.]1966年、99巻、850頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Org. Chem.]1995年、60巻、468頁、ユスタス・リービヒス・アンナー※

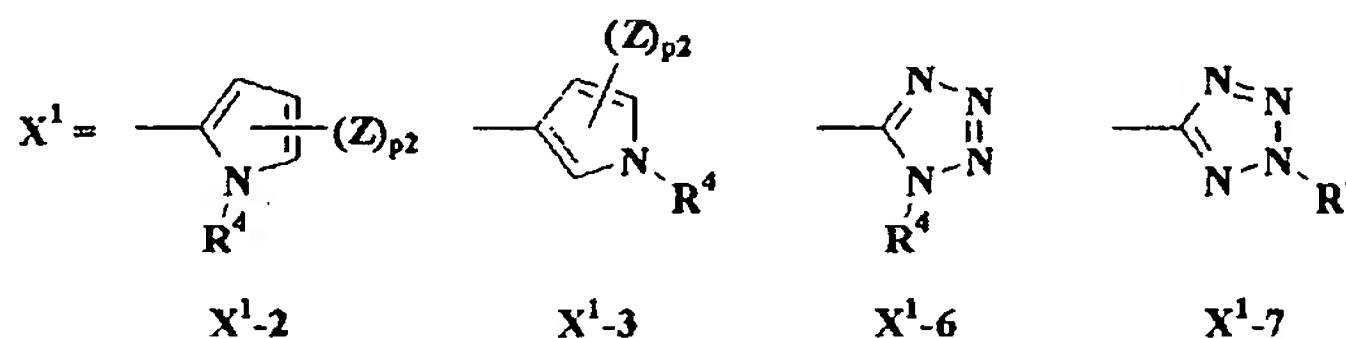
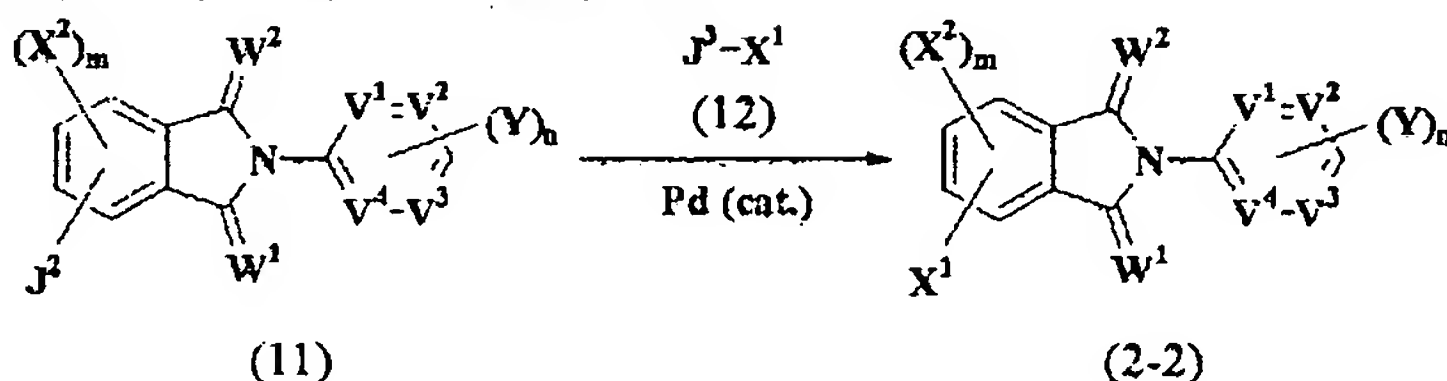
※レン・ヘミー[Justus Liebigs Ann. Chem.]1969年、725巻、29頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式(2-1)で表される化合物において、X¹がX¹-4である化合物を得ることができる。

【0095】これらの反応において出発原料として用いられる一般式(10)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、また、それ以外のものも文献記載のアニリン類の一般的な合成方法に準じて対応する置換フタル酸イミド誘導体から容易に合成することができる。

【0096】(b). 一般式(2)においてX¹がX¹-2, X¹-3, X¹-6又はX¹-7である一般式(2-2) [式中、V¹, V², V³, V⁴, W¹, W², X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物の製造。

【0097】

【化19】



【0098】一般式(11) [式中、V¹, V², V³, V⁴, W¹, W², X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表し、J²は臭素原子、ヨウ素原子、C₁~C₄ハロアルキルスルホネート(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ)又は-B(OH)₂等を表す。]で表される化合物と一般式(12) [式中、X¹はX¹-2, X¹-3, X¹-6又はX¹-7を表し、J³は臭素原子、ヨウ素原子、C₁~C₄ハロアルキルスルホネート(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ)、トリ(C₁~C₄)アルキルスタニル(例えば、-Sn(Bu-n)₃)又は-B(OH)₂等を表す。]で表される化合物と

を、文献記載の公知の方法、例えばテトラヘドロン・レターズ[Tetrahedron Lett.]1994年、35巻、2405頁、1995年、36巻、1679頁及び1996年、37巻、3247頁等に記載の方法に準じてクロスカップリング反応させることにより一般式(2-2) [式中、V¹, V², V³, V⁴, W¹, W², X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表し、X¹はX¹-2, X¹-3, X¹-6又はX¹-7を表す。]で表される化合物を得ることができる。

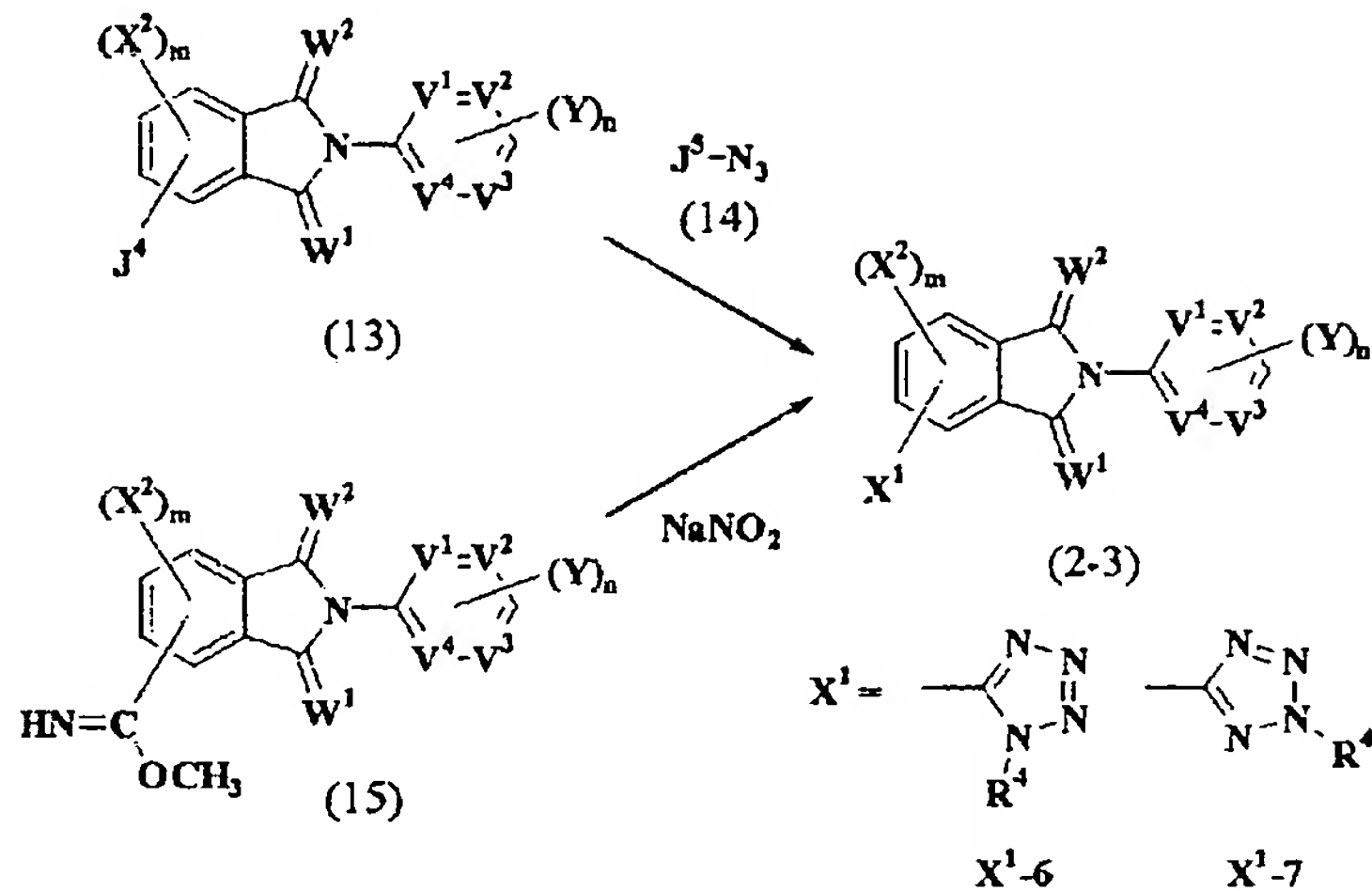
【0099】また、一般式(2-2)で表される化合物においてX¹がX¹-6又はX¹-7である一般式(2-3) [式

中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を得るための別の方法として、次のような環化反応を用いて合成すること*

*もできる。

【0100】

【化20】



【0101】すなわち、一般式(13) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表し、 J^4 はシアノ、 $-C(O)NH_2$, $-C(O)NHCH_3$ 又は $-C(O)NCH_2CH_2CN$ 等を表す。]で表される化合物と一般式(14) [式中、 J^5 はナトリウム原子、トリメチルシリル又はトリ(C₁~C₄)アルキルスタニル(例えば、 $-\text{Sn}(\text{Bu}-n)_3$)等を表す。]で表される化合物とを、文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー [J. Heterocyclic Chem.] 1998年、35巻、405頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1991年、32巻、6857頁、1993年、34巻、8011頁、1997年、38巻、1257頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1991年、56巻、2395頁、1993年、58巻、4139頁、シンセシス [Synthesis] 1996年、1428頁及びブレティン・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー・オブ・ジャパン [Bull. Chem. Soc. Jpn.] 1973年、46巻、2176頁等に記載の方法に準じて反応させるか、または、一般式(15) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 ,

20

W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と亜硝酸ナトリウムとを、文献記載の公知の方法、例えばテトラヘドロン [Tetrahedron] 1995年、51巻、11737頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式(2-3) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表し、 X^1 が X^1 -6又は X^1 -7を表す。]で表される化合物を容易に得ることができる。

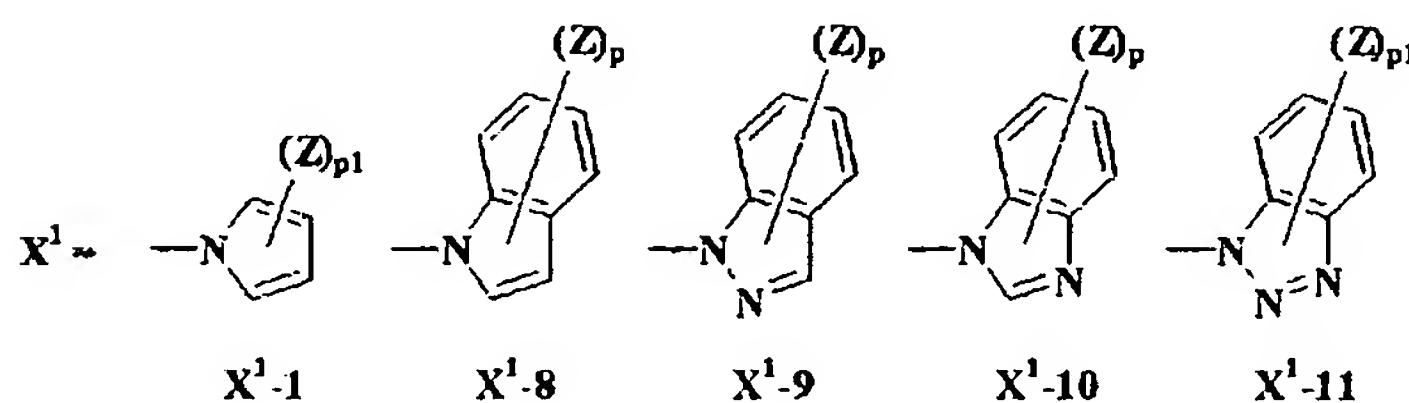
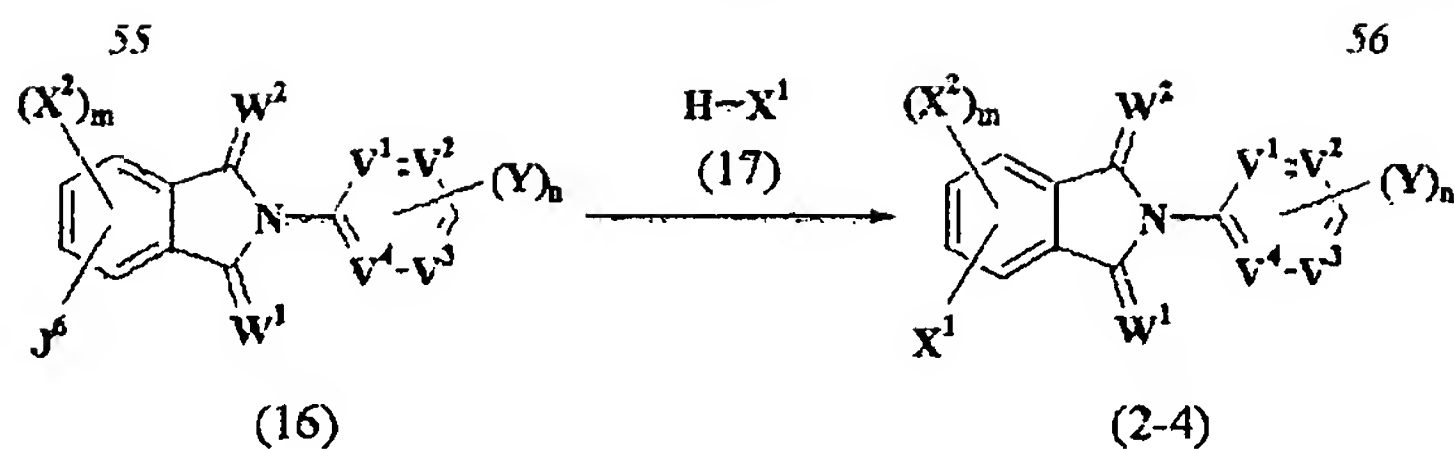
30

【0102】ここで用いられる一般式(13)で表される化合物及び一般式(15)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、また、それ以外のものも文献記載の一般的な合成方法に準じて前述の一般式(10)で表される化合物から合成することができる。

【0103】(c). 一般式(2)において X^1 が X^1 -1, X^1 -8, X^1 -9, X^1 -10又は X^1 -11である一般式(2-4) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物の製造。

【0104】

【化21】



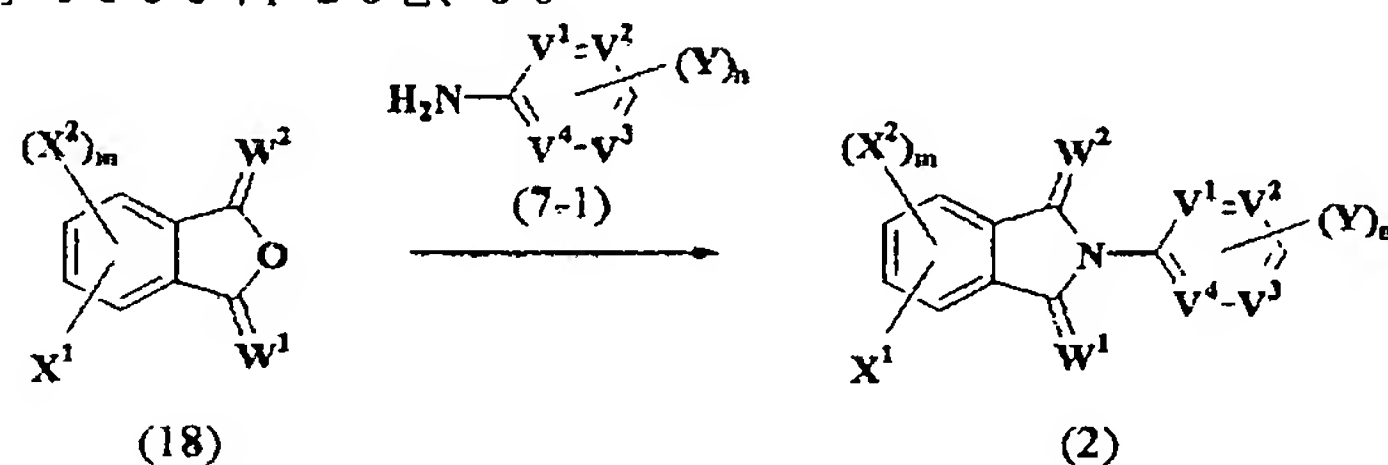
【0105】一般式(16) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表し、 J^6 はハロゲン原子又は $-B(OH)_2$ 等を表す。] で表される化合物と一般式(17) [式中、 X^1 は X^1-1 , X^1-8 , X^1-9 , X^1-10 又は X^1-11 を表す。] で表される化合物とを、文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.] 1998年、120巻、827頁、ジャーナル・オブ・ヘテロサイクリック・ケミストリー[J. Heterocyclic Chem.] 1977年、14巻、1157頁、テトラヘドロン・レターズ[Tetrahedron Lett.] 1996年、37巻、299頁、1998年、39巻、2941頁及び5617頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー[J. Med. Chem.] 1985年、28巻、66 *

*頁、シンセティック・コミュニケーションズ[Synth. Commun.] 1994年、24巻、123頁及び1995年、25巻、2165頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式(2-4) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表し、 X^1 が X^1-1 , X^1-8 , X^1-9 , X^1-10 又は X^1-11 を表す。] で表される化合物を得ることができる。

【0106】(d). また、一般式(2) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^1 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得るための別の方法として、次の方法が挙げられる。

【0107】

【化22】



【0108】すなわち、一般式(18) [式中、 W^1 , W^2 , X^1 , X^2 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と一般式(7)において R^3 が水素原子である一般式(7-1) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , Y 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、文献記載の公知の方法、例えばジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー・パーキン・トランスアクションズ、1[J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1] 1994年、2975頁、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー[J. Chem. Soc.] 1954年、2023頁、ベリヒテ・デア・ドイッチェン・ヘミッシェン・ゲゼルシャフト[Ber. Dtsch. Chem. Ges.] 1907年、40巻、3177頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式(2) [式中、 V^1 , V^2 , V^3 , V^4 , W^1 , W^2 , X^1 , X^2 , Y , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表さ

れる化合物容易に合成することができる。

【0109】製造法A、製造法C及び製造法Eにおける一般式(3)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも、文献記載の1級アミン又は2級アミンそれぞれの一般的な合成方法に準じて合成することができる。

【0110】製造法Bにおける一般式(4)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な合成方法、例えばケミストリー・レターズ[Chem. Lett.] 1976年、373頁、テトラヘドロン・レターズ[Tetrahedron Lett.] 1972年、4339頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Org. Chem.] 1976年、41巻、4028頁及び1978年、43巻、3244頁、オーガニック・

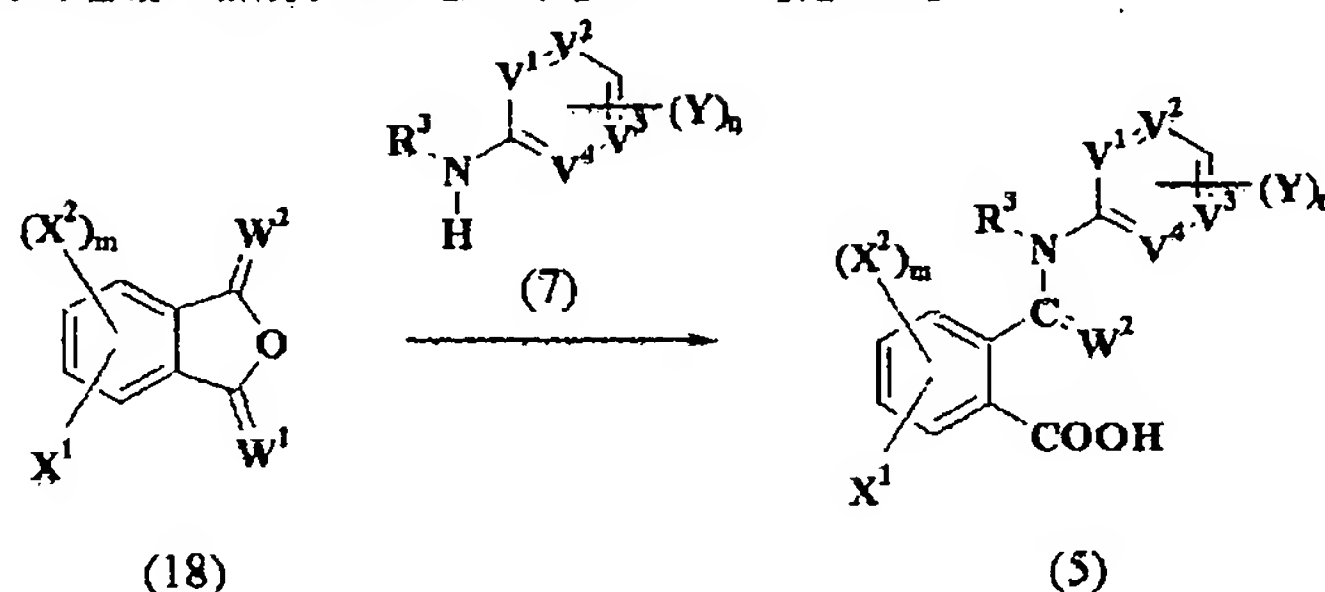
シンセシス[Org. Synth.] 1988年、コレクティブボ
リューム6巻、101頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメ
リカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. So
c.] 1964年、86巻、4383頁、英国特許(GB 2,
161,802号公報)、ヨーロッパ特許(EP 0,051,273号公
報)等に記載の方法に準じて容易に合成することができ*

＊る。

【0111】製造法Cにおいて、本発明化合物を製造す
るための原料化合物である、一般式(5)で表される化
合物は、次のようにして合成できる。

【0112】

【化23】



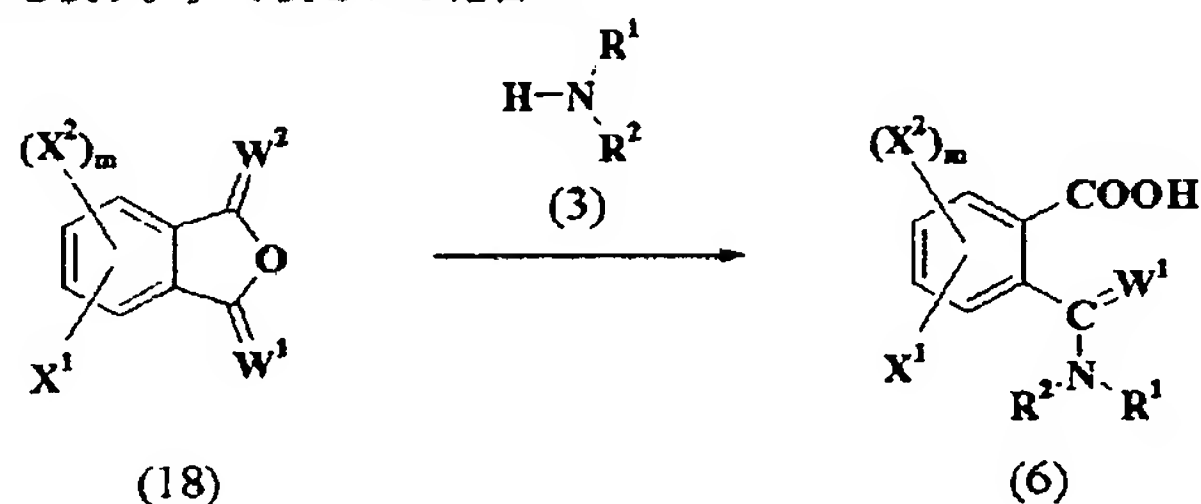
【0113】すなわち、一般式(18)〔式中、W¹,
W², X¹, X²及びmは前記と同じ意味を表す。〕で表され
る化合物と、一般式(7)〔式中、V¹, V², V³, V⁴, Y,
R³及びnは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物
とを、製造法Aと同様な条件下反応させることにより、
一般式(5)〔式中、V¹, V², V³, V⁴, W², X¹, X², Y,
R³, m及びnは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合*

＊物を得ることができる。

【0114】製造法Dにおいて、本発明化合物を製造す
るための原料化合物である、一般式(6)で表される化
合物は、次のようにして合成できる。

【0115】

【化24】



【0116】すなわち、一般式(18)〔式中、W¹,
W², X¹, X²及びmは前記と同じ意味を表す。〕で表され
る化合物と、一般式(3)〔式中、R¹及びR²は前記と同
じ意味を表す。〕で表される化合物とを、製造法Aと同
様な条件下反応させることにより、一般式(6)〔式
中、W¹, X¹, X², R¹, R²及びmは前記と同じ意味を表
す。〕で表される化合物を得ることができる。

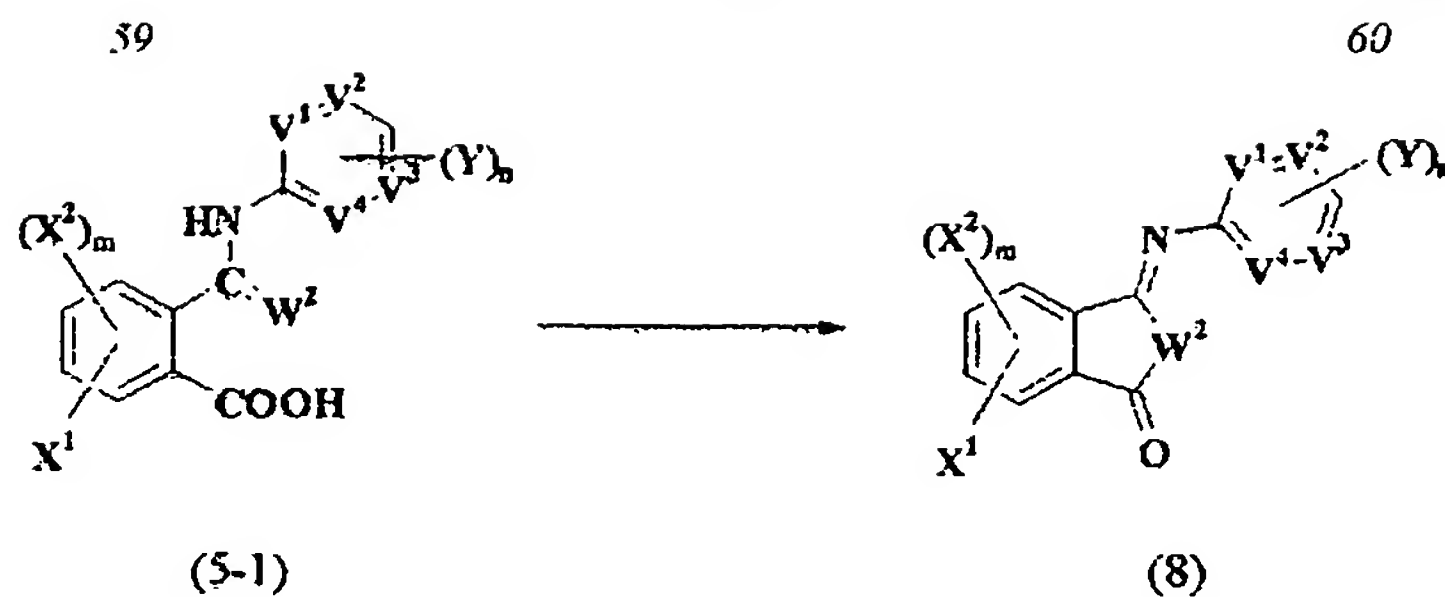
【0117】製造法D及び製造法Fにおける一般式(7)
で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部
は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文
献記載のアニン類の一般的な合成方法、例えばザ・ジ
ャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Or
g. Chem.] 1964年、29巻、1頁、アンゲバンテ・

ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イ
ングリッシュ[Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1985
年、24巻、871頁、シンセシス[Synthesis] 19
84年、667頁、日本化学会誌1973年、2351
頁、ドイツ国特許(DE 2606982号公報)、日本国特許
(特開平 1-90163号公報)等に記載の方法に準じて容易
に合成することができる。

【0118】製造法Eにおいて、本発明化合物を製造す
るための原料化合物である、一般式(8)で表される化
合物は、次のようにして合成できる。

【0119】

【化25】



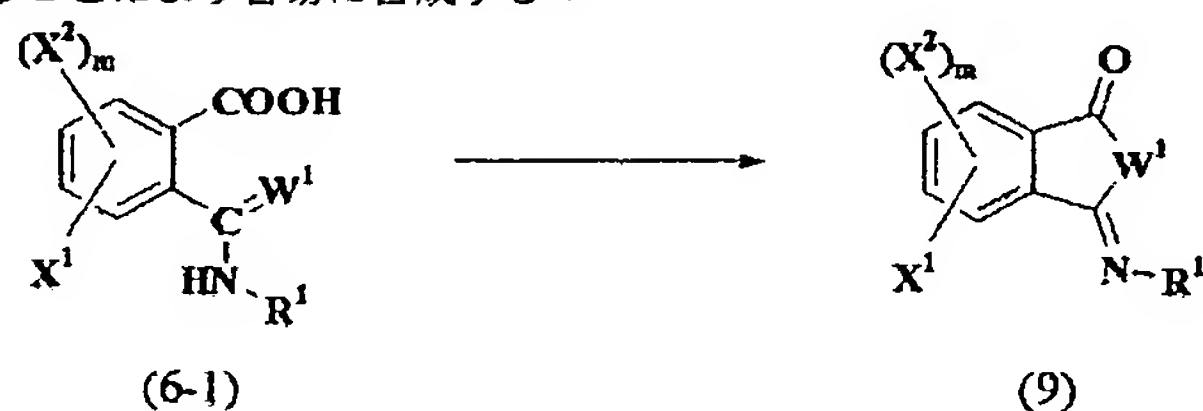
【0120】すなわち、一般式(5)においてR³が水素原子である一般式(5-1)〔式中、V¹, V², V³, V⁴, W², X¹, X², Y, m及びnは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を、文献記載の一般的な脱水環化反応、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1967年、10巻、982頁等に記載の方法に準じて環化することにより容易に合成する*

10 *ことができる。

【0121】製造法Fにおいて、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(9)で表される化合物は、次のようにして合成できる。

【0122】

【化26】



【0123】すなわち、一般式(6)においてR¹が水素原子である一般式(6-1)〔式中、W¹, X¹, X², R¹及びmは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物を、文献記載の一般的な脱水環化反応、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1967年、10巻、982頁等に記載の方法に準じて環化することにより容易に合成することができる。

※に準じて容易に合成することができる。

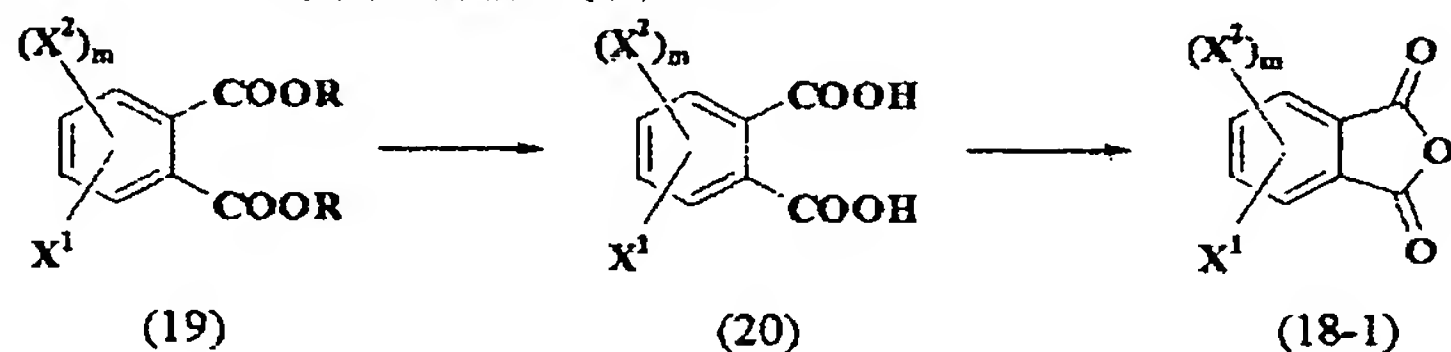
【0124】一般式(11)で表される化合物及び一般式(16)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、また、それ以外のものも文献記載の一般的な合成方法、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1998年、63巻、2054頁、1997年、62巻、6458頁及び1995年、60巻、7508頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1997年、38巻、3447頁及び1985年、26巻、5997頁、シンセシス [Synthesis] 1994年、1146頁等に記載の方法

30 【0126】一般式(14)で表される化合物は公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の公知の合成方法にて容易に合成することができる。

【0127】一般式(18)においてW¹及びW²が酸素原子である一般式(18-1)〔式中、X¹, X²及びmは前記と同じ意味を表す。〕で表される化合物は、次のようにして合成できる。

【0128】

【化27】



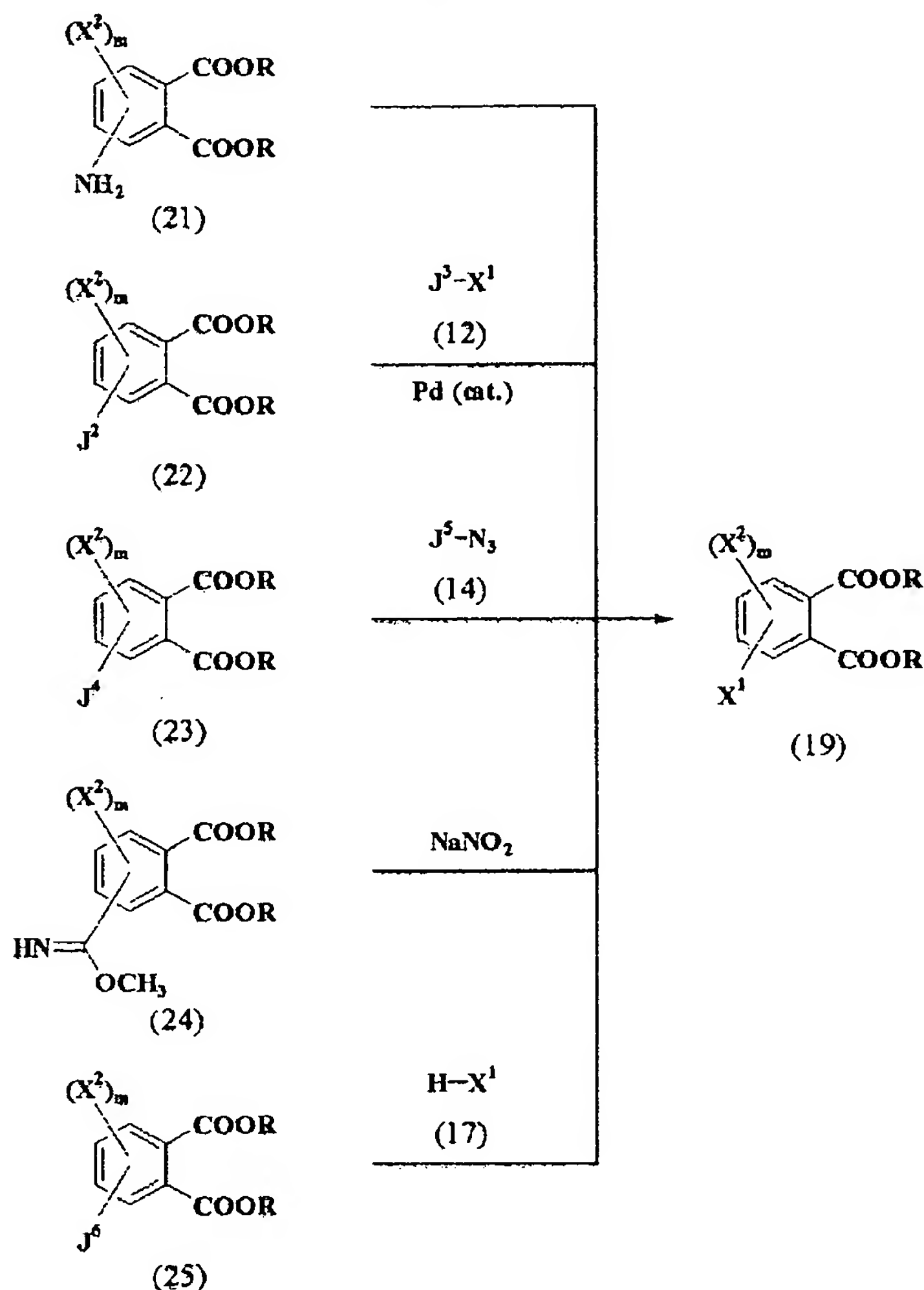
【0129】すなわち、一般式(19)〔式中、X¹, X²及びmは前記と同じ意味を表し、Rはメチル、エチル等の低級アルキルを表す。〕で表される化合物を、文献記載の一般的な加水分解反応、例えばジャーナル・オブ・ジ

50 ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1929年、51巻、1865頁、アンゲバンテ・ヘミー [Angew. Chem.] 1951年、63巻、329頁等に記載の方法に準じて一般式(20)〔式中、X¹,

61

X^2 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表されるフタル酸誘導体とした後、文献記載の一般的な脱水環化反応、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1987年、52巻、129頁等に記載の方法に準じた条件下反応させることにより、一般式(18-1)で表される化合物を得ることができる。

*



62

*【0130】一般式(19) [式中、 X^1 、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物は、次のようにして合成できる。

【0131】

【化28】

【0132】すなわち、一般式(21) [式中、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物を、一般式(2-1)で表される化合物の製造と同様の条件下反応させるか、一般式(22) [式中、 J^2 、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物と一般式(12) [式中、 J^3 は前記と同じ意味を表し、 X^1 は $X^1\text{-2}$ 、 $X^1\text{-3}$ 、 $X^1\text{-6}$ 又は $X^1\text{-7}$ を表す。]で表される化合物とを、一般式(2-2)で表される化合物の製造と同様の条件下反応させるか、一般式(23) [式中、 J^4 、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物と一般式(14) [式中、 J^5 は前記と

同じ意味を表す。]で表される化合物、又は一般式(24) [式中、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物と亜硝酸ナトリウムとを、一般式(2-3)で表される化合物の製造と同様の条件下反応させるか、或いは一般式(25) [式中、 J^6 、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物と一般式(17) [式中、 X^1 は $X^1\text{-1}$ 、 $X^1\text{-8}$ 、 $X^1\text{-9}$ 、 $X^1\text{-10}$ 又は $X^1\text{-11}$ を表す。]で表される化合物とを、一般式(2-4)で表される化合物の製造と同様の条件下反応させることにより一般式(19) [式中、 X^1 、 X^2 及び m は前記と同じ意味を表し、 R はメチル、エチル等の低級アルキルを表す。]で表される化合物を

得ることができる。

【0133】一般式(21)で表される化合物、一般式(22)で表される化合物、一般式(23)で表される化合物、一般式(24)で表される化合物及び一般式(25)で表される化合物の或るものは公知化合物(例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Org. Chem.] 1987年、52巻、129頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.] 1929年、51巻、1865頁等に記載の化合物。)であり、また、それ以外のものも文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

【0134】これらの各反応においては、反応終了後、通常の後処理を行なうことにより、製造法A~Fの原料化合物となる各々の製造中間体を得ることができる。

【0135】またこれらの方法により製造された各々の製造中間体は、単離・精製することなく、それぞれそのまま次工程の反応に用いることもできる。

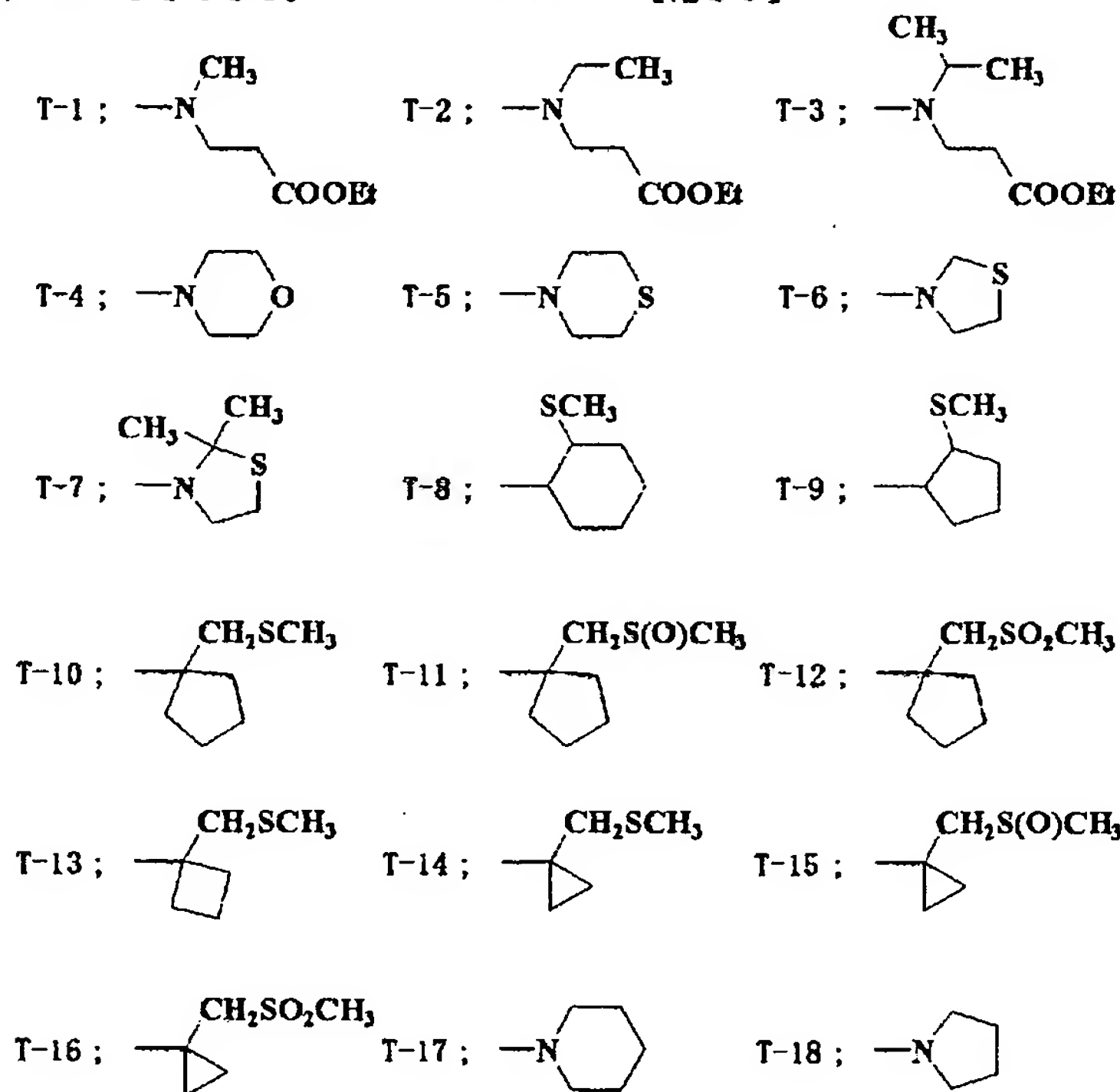
*

*【0136】本発明に包含される化合物としては、具体的に例えば、第1表~第3表に示す化合物が挙げられる。但し、第1表~第3表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらにのみ限定されるものではない。

【0137】尚、表中Etとの記載はエチルを表し、以下同様にn-Pr及びPr-nはノルマルプロピルを、i-Pr及びPr-iはイソプロピルを、c-Pr及びPr-cはシクロプロピルを、n-Bu及びBu-nはノルマルブチルを、s-Bu及びBu-sはセカンダリーブチルを、i-Bu及びBu-iはイソブチルを、t-Bu及びBu-tはターシャリーブチルを、c-Bu及びBu-cはシクロブチルを、n-Pen及びPen-nはノルマルペンチルを、c-Pen及びPen-cはシクロペンチルを、n-Hex及びHex-nはノルマルヘキシルを、c-Hex及びHex-cはシクロヘキシルを、Phはフェニルを、Naphはナフチルをそれぞれ表し、表中T-1~T-18は、それぞれ下記の構造を表し、

【0138】

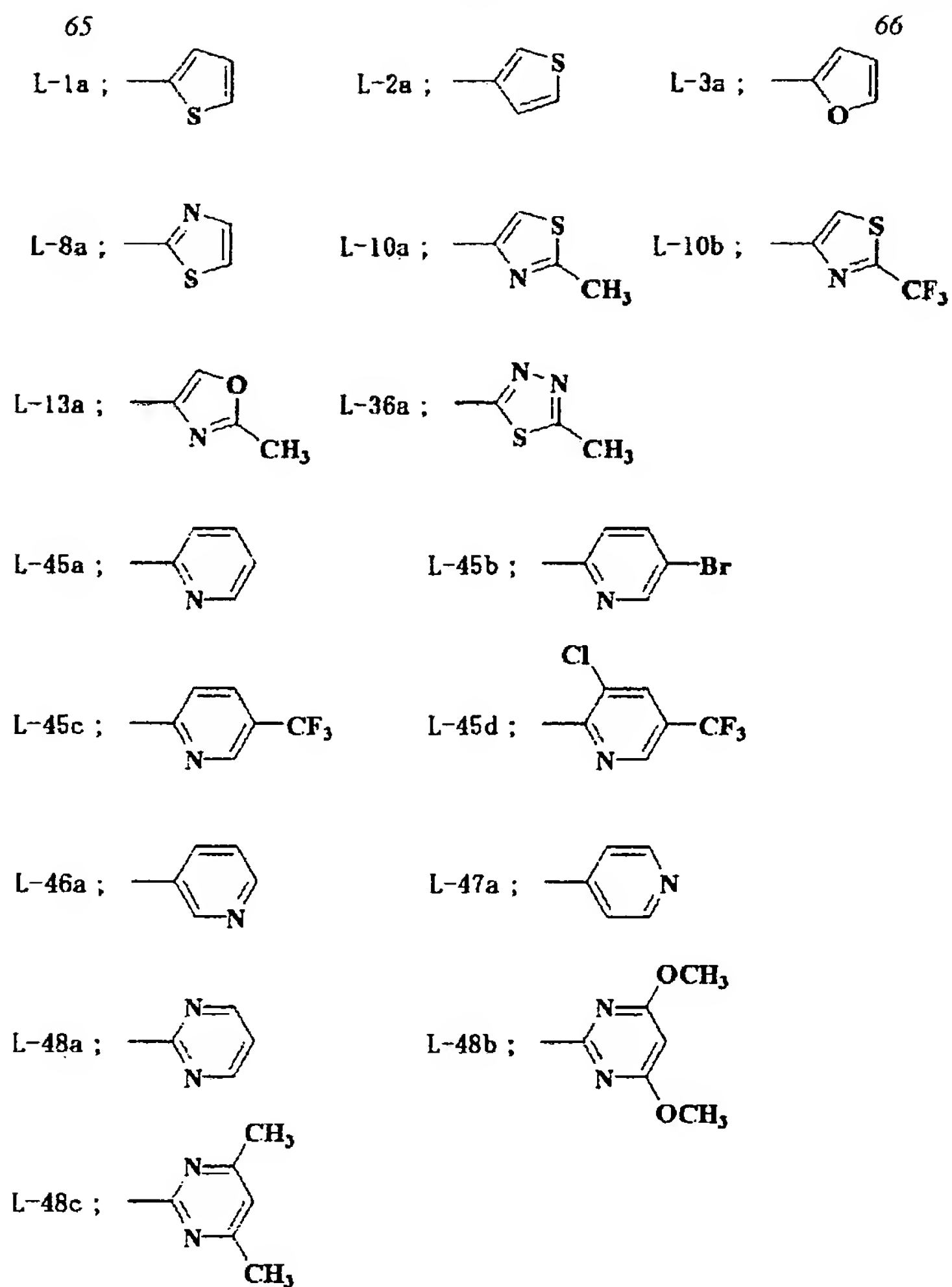
【化29】



【0139】表中L-1a~L-48bで表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

【0140】

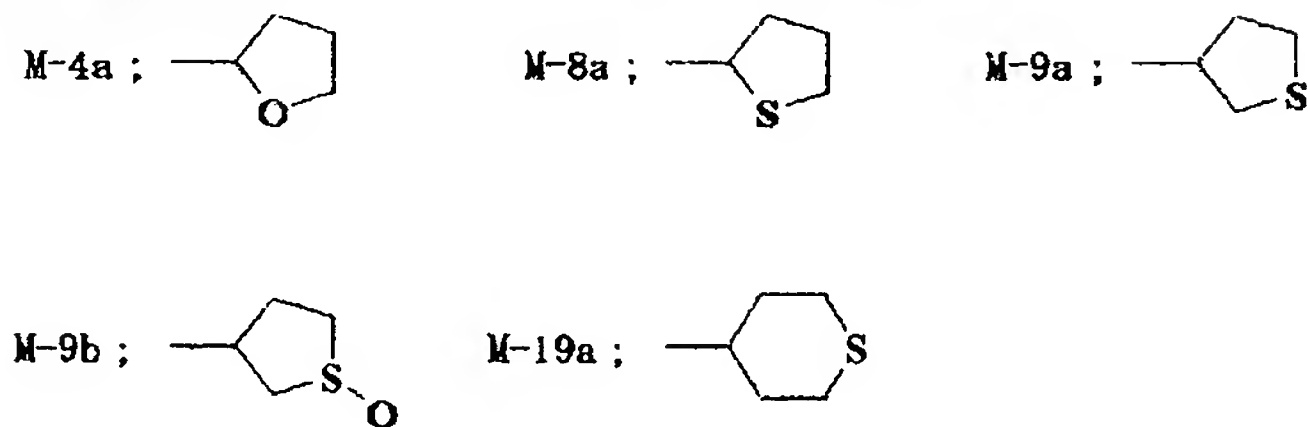
【化30】



【0141】さらに、表中M-4a～M-19aで表される脂肪族複素環は、それぞれ下記の構造を表す。

*【0142】

*30 【化31】



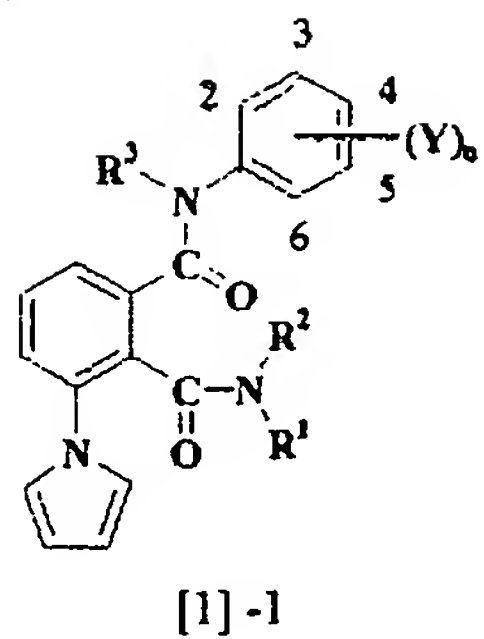
【0143】また、表中、置換基Y及び置換基Zの置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

第1表

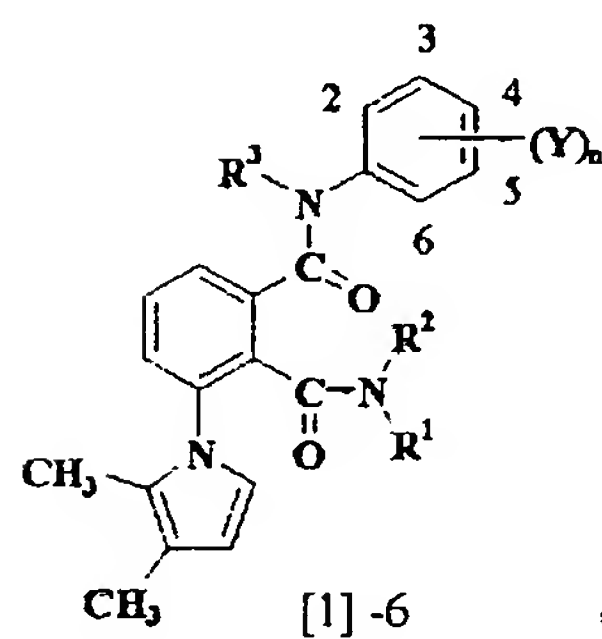
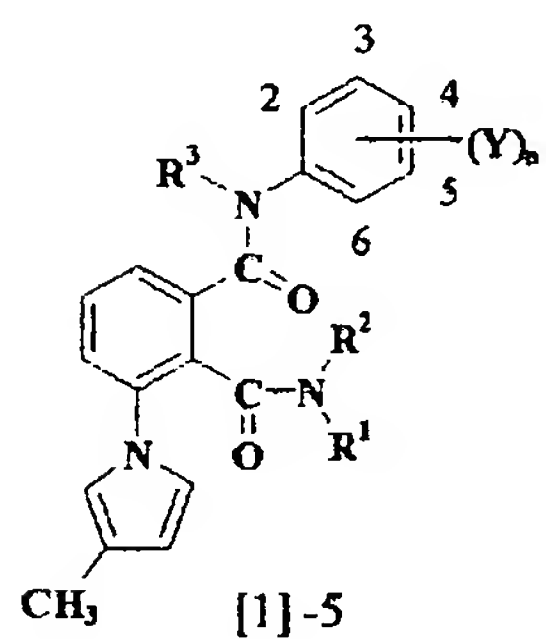
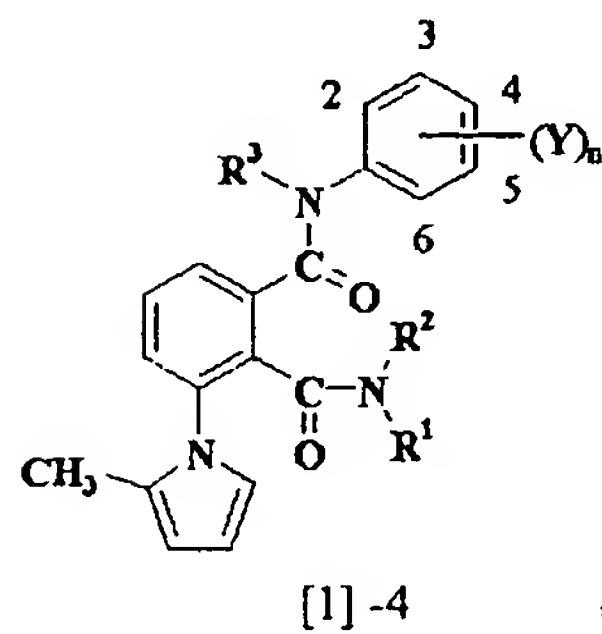
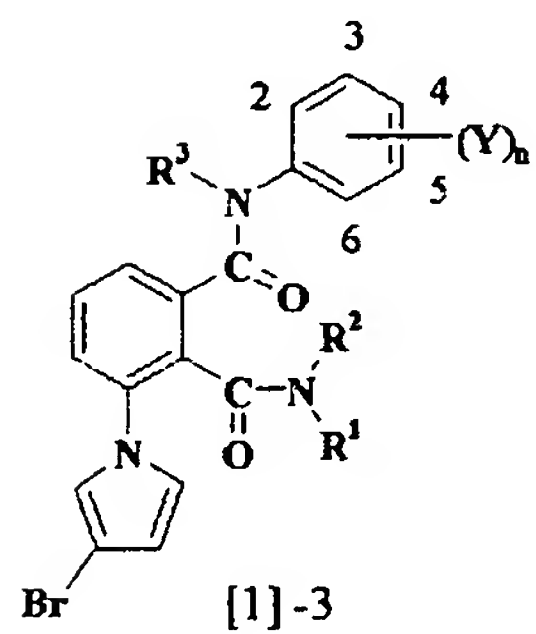
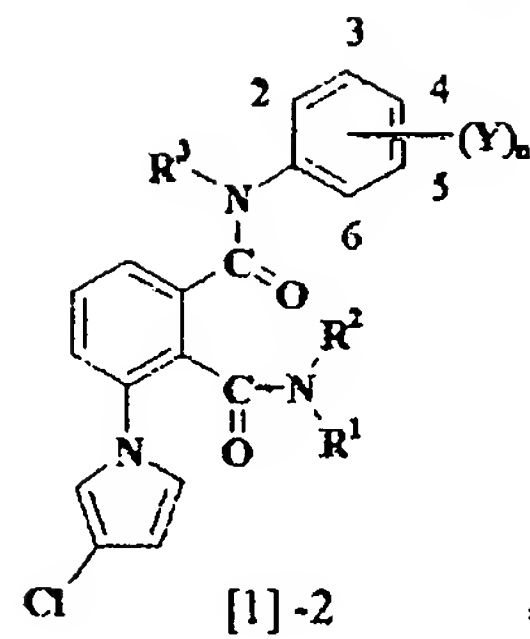
【0144】

40 【化32】

67



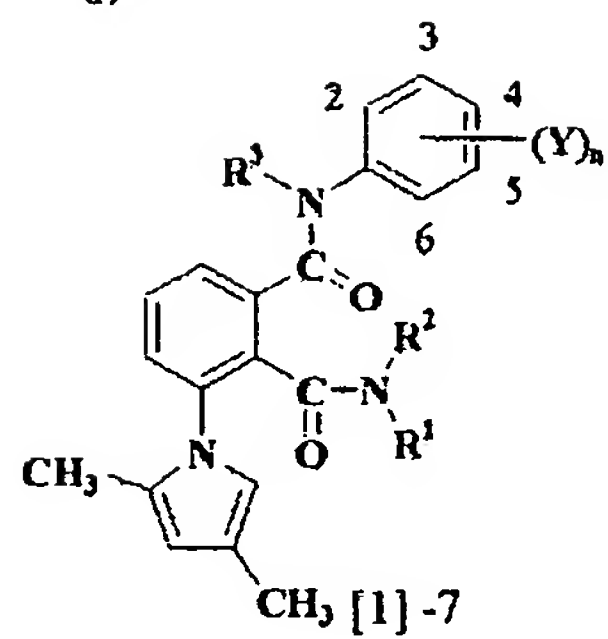
68



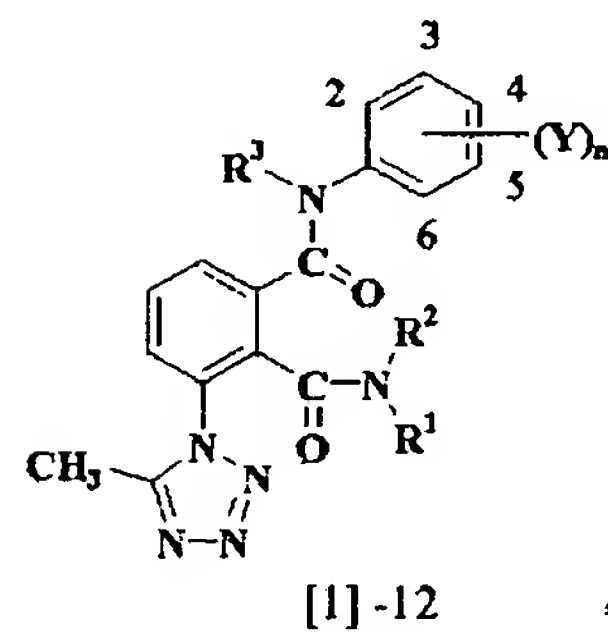
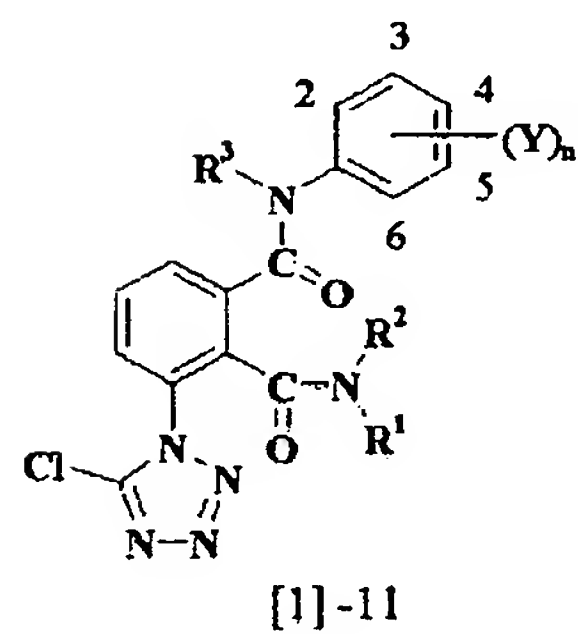
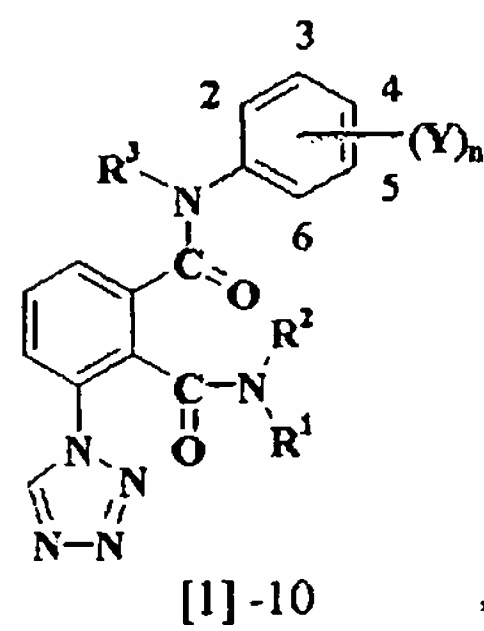
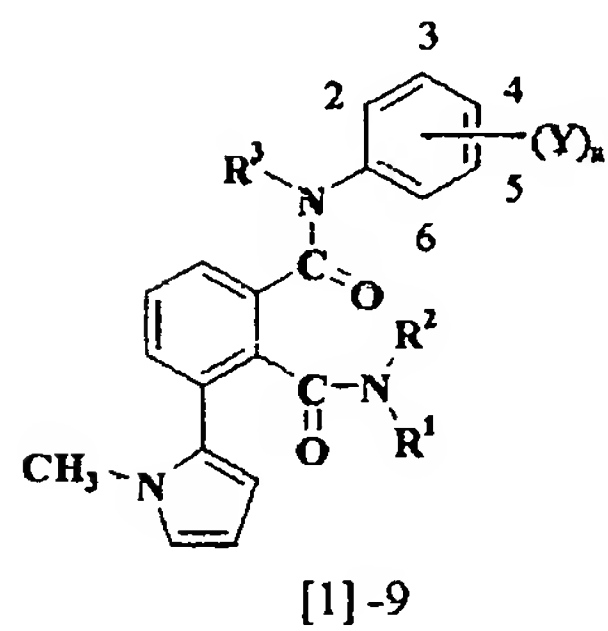
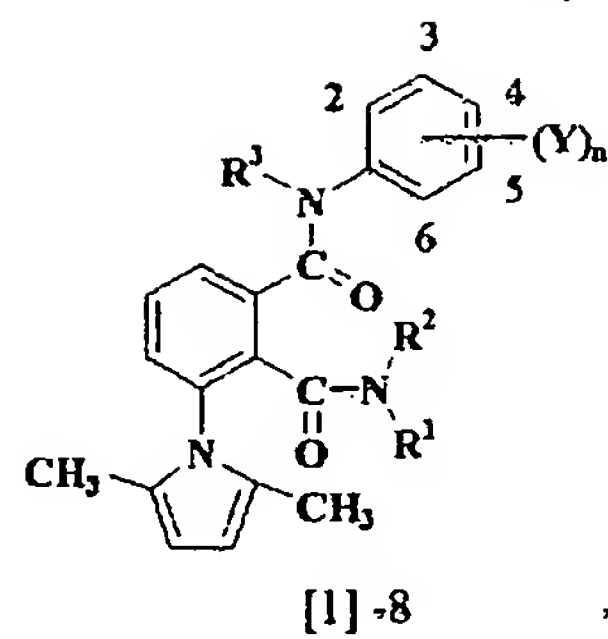
【0145】

【化33】

69



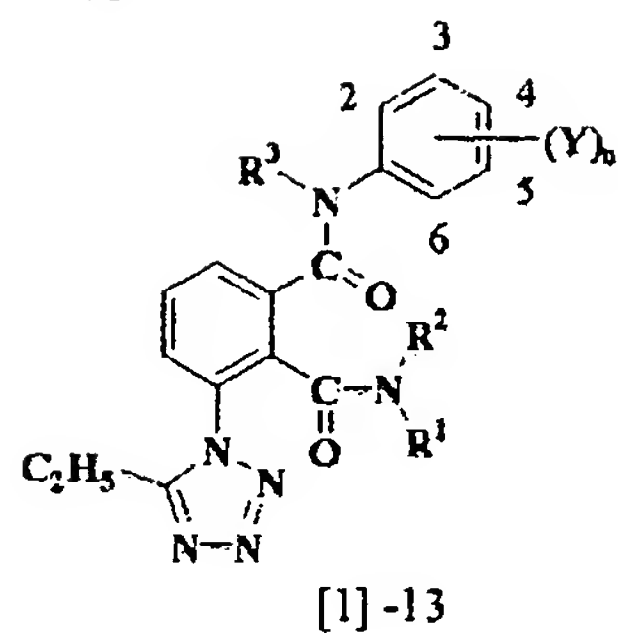
70



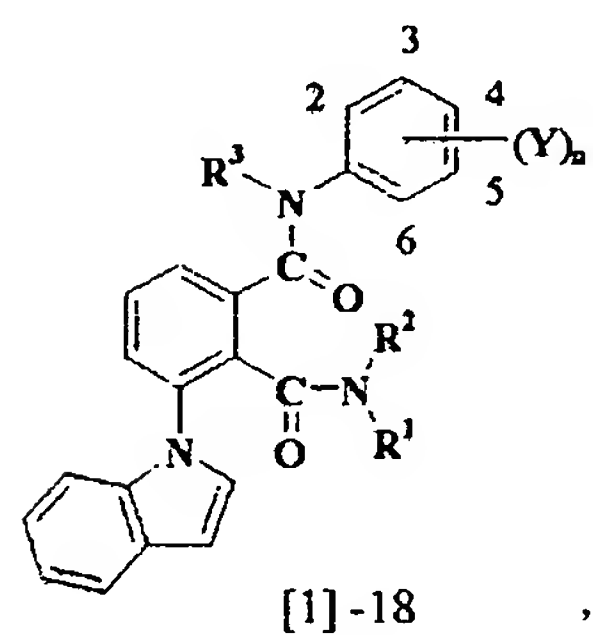
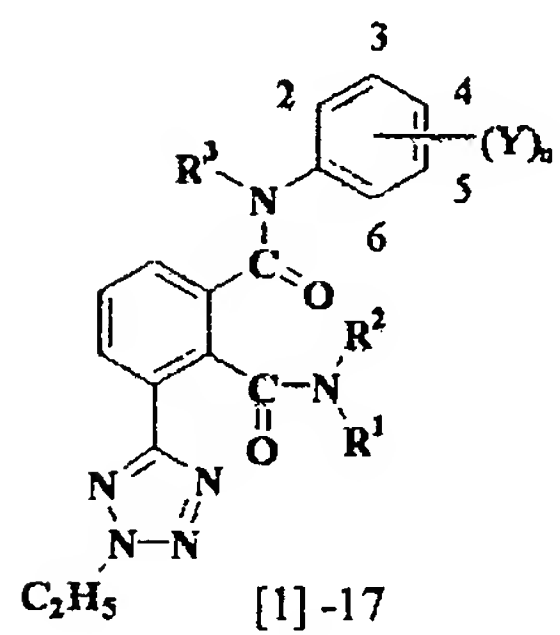
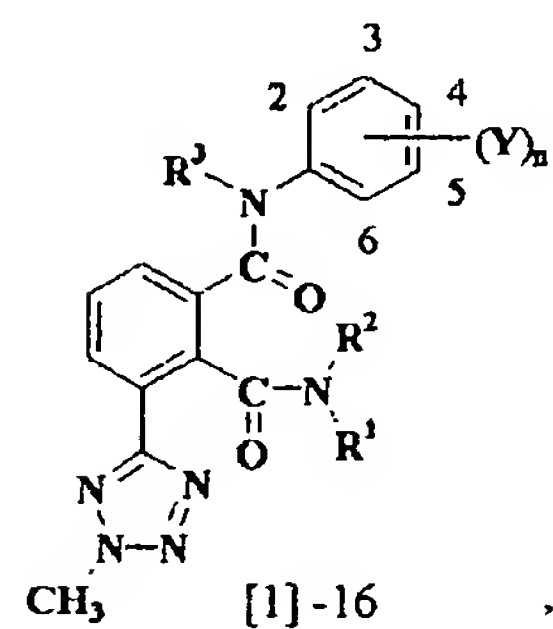
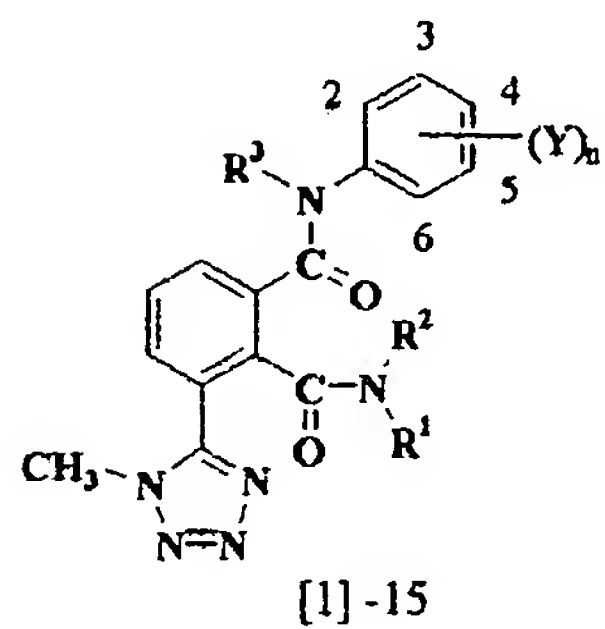
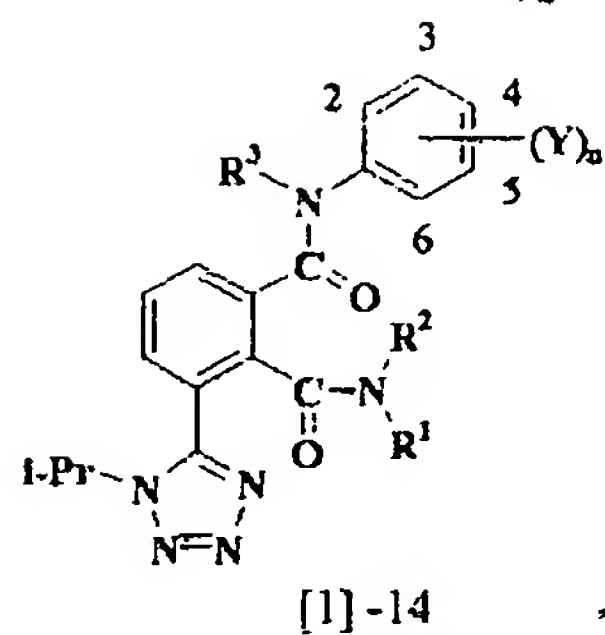
【0146】

【化34】

71



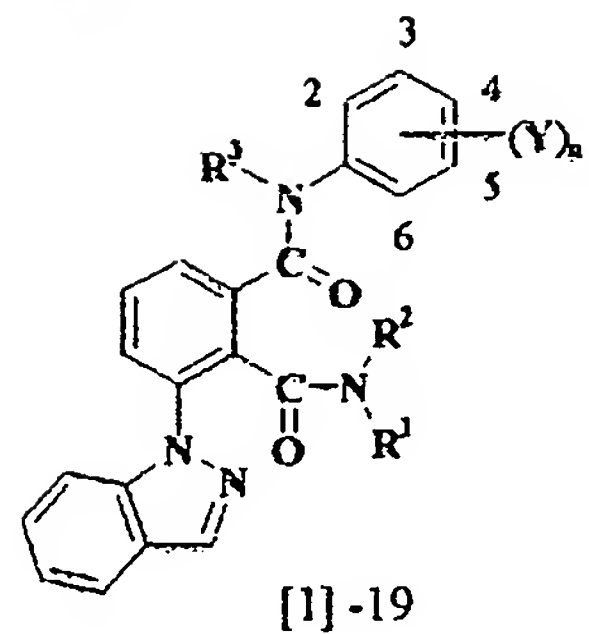
72



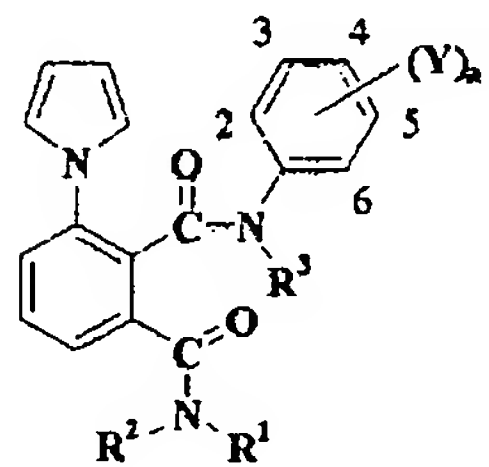
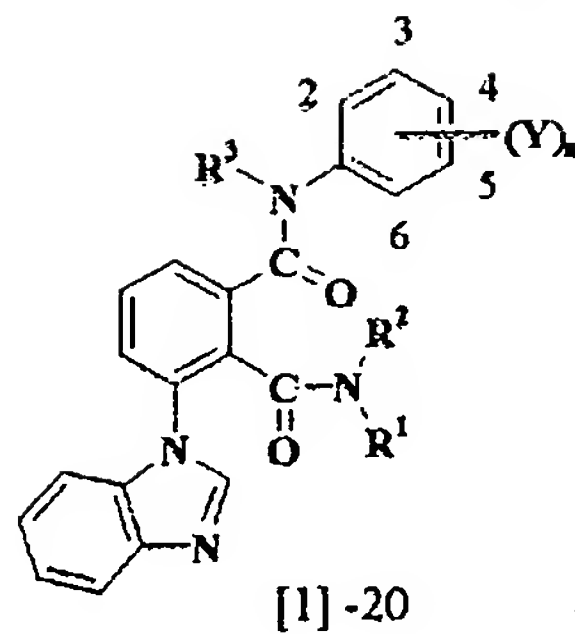
【0147】

【化35】

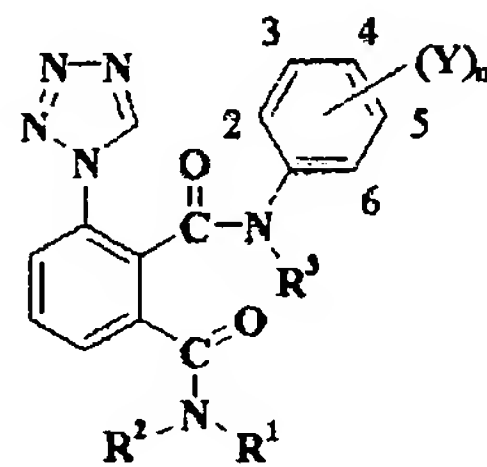
73



74



または



【0148】

【表1】

R ¹	R ²	R ³	(Y) _n
H	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₃	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
CH ₃	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₃	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	H	H	4-CF ₃
Et	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
Et	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
Et	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
Et	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
Et	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂
Et	Et	H	4-CF ₃
Et	Et	H	4-C(CF ₃) ₂ OH
Et	Et	H	4-OCF ₃
Et	Et	H	4-SCF ₃
Et	Et	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	H	2-F-4-OCF ₃
Et	Et	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃

Et	Et	H	2-CH ₃ -4-Cl
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-F)
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-Cl)
Et	Et	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-CF ₃)
Et	Et	H	2-Et-4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	H	2-Et-4-OCF ₃
Et	Et	H	3-OCF ₂ O-4
Et	Et	H	3-OCF ₂ CHF ₂ O-4
Et	Et	H	3-OCF ₂ CHFO-4
Et	Et	H	3-OC(CF ₂ CF ₃)=N-4
Et	Et	H	3-OC(Ph-2-CF ₃)=N-4
Et	Et	H	3-N=C(Ph-4-CF ₃)O-4
Et	Et	CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	Et	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	CH ₂ OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	CH ₂ OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ OCH ₃	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	CH ₂ OEt	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	CH ₂ OEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ OEt	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	CH ₂ SCH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	CH ₂ SCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ SCH ₃	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	CH ₂ SEt	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	CH ₂ SEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ SEt	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	CH ₂ C(O)CH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ COOCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ COOEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ CN	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ CH=CH ₂	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CH ₂ C≡CH	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	C(O)CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	C(O)CH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	C(O)CH ₃	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	C(O)Et	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	C(O)Ph	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	C(O)OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	C(O)OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	C(O)OCH ₃	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	C(O)OEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	CN	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SCCl ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SPh	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂

77

78

Et	Et	SN(Et) ₂	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Pr-i) ₂	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Bu-n) ₂	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	SN(Bu-n) ₂	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Bu-n) ₂	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	S-(T-4)	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	S-(T-4)	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S-(T-4)	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	S-(T-1)	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S-(T-2)	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S-(T-3)	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	S-(T-3)	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S-(T-3)	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	SN(CH ₃)COOEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(CH ₃)COOPr-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(CH ₃)COOBu-n	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	SN(CH ₃)COOBu-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(CH ₃)COOBu-n	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	SN(CH ₃)COOHex-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Et)COOEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Et)COOPr-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Et)COOBu-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Pr-i)COOEt	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Pr-i)COOPr-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	SN(Pr-i)COOBu-n	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S(O) ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
Et	Et	S(O) ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S(O) ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-OCF ₃
Et	Et	S(O) ₂ Et	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	S(O) ₂ Ph	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
Et	Et	NHC(O)CH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
n-Pr	H	H	4-CF ₃
n-Pr	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
n-Pr	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
n-Pr	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
n-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-Cl
n-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
n-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
n-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
n-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
n-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂
n-Pr	H	H	2-OCH ₃ -5-Ph
n-Pr	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
n-Pr	Et	H	4-OCF ₂
n-Pr	Et	H	4-OCF ₃
n-Pr	Et	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
n-Pr	Et	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
n-Pr	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
n-Pr	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
n-Pr	n-Pr	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃

n-Pr	n-Pr	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
n-Pr	n-Pr	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
n-Pr	n-Pr	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	H
i-Pr	H	H	2-F
i-Pr	H	H	2-Cl
i-Pr	H	H	2-Br
i-Pr	H	H	2-CH ₃
i-Pr	H	H	2-Et
i-Pr	H	H	2-CF ₃
i-Pr	H	H	2-OCH ₃
i-Pr	H	H	2-SCH ₃
i-Pr	H	H	3-F
i-Pr	H	H	3-Cl
i-Pr	H	H	3-Br
i-Pr	H	H	3-CH ₃
i-Pr	H	H	3-CF ₃
i-Pr	H	H	3-OCH ₃
i-Pr	H	H	3-OPr-i
i-Pr	H	H	3-OCHF ₂
i-Pr	H	H	3-SCH ₃
i-Pr	H	H	3-SCF ₃
i-Pr	H	H	3-S(O)CF ₃
i-Pr	H	H	3-(L-10b)
i-Pr	H	H	3-(L-13a)
i-Pr	H	H	4-F
i-Pr	H	H	4-Cl
i-Pr	H	H	4-Br
i-Pr	H	H	4-I
i-Pr	H	H	4-CH ₃
i-Pr	H	H	4-Et
i-Pr	H	H	4-Pr-n
i-Pr	H	H	4-Pr-i
i-Pr	H	H	4-Bu-n
i-Pr	H	H	4-Bu-t
i-Pr	H	H	4-CF ₃
i-Pr	H	H	4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	4-CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-C(CF ₃) ₂ OH
i-Pr	H	H	4-OCH ₃
i-Pr	H	H	4-OCHF ₂
i-Pr	H	H	4-OCF ₃
i-Pr	H	H	4-OCF ₂ CHFOCF ₃
i-Pr	H	H	4-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-SCHF ₂
i-Pr	H	H	4-SCF ₃
i-Pr	H	H	4-SCF ₂ Br
i-Pr	H	H	4-SCH ₂ CF ₃

i-Pr	H	H	4-SCF ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	4-SCF ₂ CF ₂ Br
i-Pr	H	H	4-SCF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-SCF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	4-SCF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-S(O)CF ₃
i-Pr	H	H	4-S(O)CF ₂ Br
i-Pr	H	H	4-SO ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	4-NO ₂
i-Pr	H	H	4-C(O)CH ₃
i-Pr	H	H	4-C(CH ₃)=NOCH ₃
i-Pr	H	H	4-C(CH ₃)=NOCH ₂ CH=CH ₂
i-Pr	H	H	4-CN
i-Pr	H	H	4-CH=CCl ₂
i-Pr	H	H	4-CH=CBr ₂
i-Pr	H	H	4-CH=C(Cl)CF ₃
i-Pr	H	H	4-Ph
i-Pr	H	H	4-(L-10b)
i-Pr	H	H	2,4-F ₂
i-Pr	H	H	2-F-4-Cl
i-Pr	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-F-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-F-4-OCF ₃
i-Pr	H	H	2-F-4-O(Ph-2-Cl-4-CF ₃)
i-Pr	H	H	2,5-F ₂
i-Pr	H	H	2,3-Cl ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-4-F
i-Pr	H	H	2,4-Cl ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-4-CH ₃
i-Pr	H	H	2-Cl-4-CF ₃
i-Pr	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
i-Pr	H	H	2,5-Cl ₂
i-Pr	H	H	2,6-Cl ₂
i-Pr	H	H	2-Br-4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Br-4-OCF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-F
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-Cl
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-OCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-OCHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-OCF ₂ CHFCI
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-F
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-Br

i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-I
i-Pr	H	H	2, 4-(CH ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CH ₂ CH ₂ Bu ^t
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ (CF ₂) ₄ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OPr ⁱ
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ Br
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCH ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFCI
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CF ₂ Br
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CFCI ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CCl ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCH ₂ CF ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFCF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CFBrCF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CF ₂ Ph
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCH ₂ OCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCH ₂ SCCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OC(CF ₂ CF ₃)=C(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OC(OCH ₃)=C(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-O(Ph-3-CF ₃)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-O(Ph-2-Cl-4-CF ₃)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OC ₆ F ₅
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45c)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45d)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-48a)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-48b)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OP(S)(OCH ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SCCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SPPr ⁱ
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SCHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SCF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SCF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SCH ₂ CH ₂ CF=CF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-S(Ph-4-Cl)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-S(O)CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-S(O)CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF=CF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-NO ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C(O)CF ₃

85

86

i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C(CH ₃)=NOCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C(O)OCH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C(O)OCH ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CN
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C≡CBu-t
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C≡CPh
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-C≡C(Ph-2,4-Cl ₂)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-CF ₃)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-OCF ₃)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-(L-10a)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-P(O)(OEt) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -5-F
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -5-Br
i-Pr	H	H	2,5-(CH ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -5-(L-10a)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-Cl
i-Pr	H	H	2,6-(CH ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Et-4-Cl
i-Pr	H	H	2-Et-4-I
i-Pr	H	H	2-Et-4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Et-4-OCF ₃
i-Pr	H	H	2-Et-5-F
i-Pr	H	H	2,6-(Et) ₂
i-Pr	H	H	2-(Pr-n)-4-I
i-Pr	H	H	2-(Pr-i)-4-I
i-Pr	H	H	2-(Pr-l)-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-(Bu-n)-4-I
i-Pr	H	H	2-CF ₃ -4-Cl
i-Pr	H	H	2-CF ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CF ₃ -4-OCF ₂
i-Pr	H	H	2-CF ₂ CF ₃ -4-Br
i-Pr	H	H	2,4-(CF ₂ CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-OCF ₂ O-3
i-Pr	H	H	2-OCH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-OCH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-OCH ₃ -5-Ph
i-Pr	H	H	2-OEt-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-OPh-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-SCH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-SCH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Ph-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	3,4-F ₂
i-Pr	H	H	3-F-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	3-F-4-OCF ₂
i-Pr	H	H	3-Cl-4-F
i-Pr	H	H	3,4-Cl ₂
i-Pr	H	H	3-Cl-4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	3-Cl-4-CF(CF ₃) ₂

i-Pr	H	H	3-Cl-4-OCHF ₂
i-Pr	H	H	3,5-Cl ₂
i-Pr	H	H	3-CH ₃ -4-Br
i-Pr	H	H	3-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	3-CF ₃ -4-Cl
i-Pr	H	H	3-CF ₃ -4-OCHF ₂
i-Pr	H	H	3-CF ₃ -5-OCH ₃
i-Pr	H	H	3-OCH ₃ -4-OCHF ₂
i-Pr	H	H	3,4-(OCHF ₂) ₂
i-Pr	H	H	3-SCH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	3-OCH ₂ O-4
i-Pr	H	H	3-OCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ -4
i-Pr	H	H	3-OCHFCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	3-OCF ₂ CHFO-4
i-Pr	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4
i-Pr	H	H	3-OCF ₂ OCF ₂ -4
i-Pr	H	H	3-OC(CF ₂ CF ₃)=N-4
i-Pr	H	H	3-OC(CF ₂ CF ₂ CF ₃)=N-4
i-Pr	H	H	3-SC(Pr-i)=N-4
i-Pr	H	H	3-N=C(CF ₃)O-4
i-Pr	H	H	3-N=C(CF ₂ CF ₃)O-4
i-Pr	H	H	3-N=C(CF ₂ CF ₂ CF ₃)O-4
i-Pr	H	H	3-N=C(Ph-4-CF ₃)O-4
i-Pr	H	H	3-N=C(CF ₃)NH-4
i-Pr	H	H	3-N=C(CF ₃)N(CH ₃)-4
i-Pr	H	H	2,3,4-F ₃
i-Pr	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2,3,4-Cl ₃
i-Pr	H	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃
i-Pr	H	H	2-Cl-3-OCHFCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	2-Cl-3-OCF ₂ CHFO-4
i-Pr	H	H	2-Cl-3-OCF ₂ CF ₂ O-4
i-Pr	H	H	2-Cl-3-N=C(CF ₃)O-4
i-Pr	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2-Cl-4-OCHFCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ CHFO-5
i-Pr	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ CF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂ -5-CH ₃
i-Pr	H	H	2-Br-4-OCF ₂ CHFO-5
i-Pr	H	H	2-I-4-OCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2,4-(CH ₃) ₂ -3-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -3-Cl-4-OCHF ₂
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-Cl
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-Br
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-OCH ₃
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-SCH ₃
i-Pr	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-NO ₂

i-Pr	H	H	2, 4-(CH ₃) ₂ -3-OCH ₃
i-Pr	H	H	2, 4-(CH ₃) ₂ -3-OCHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4, 5-Cl ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃ -5-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃ -5-CH ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂ -5-F
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂ -5-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂ -5-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂ -5-Cl
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCHFCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OC(CF ₃)=N-5
i-Pr	H	H	2, 4, 6-(CH ₃) ₃
i-Pr	H	H	2, 6-(CH ₃) ₂ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2, 6-(CH ₃) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2, 6-(Et) ₂ -3-Cl
i-Pr	H	H	2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-OCF ₂ O-3-6-Cl
i-Pr	H	H	2-N=CHS-3-4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	3, 5-Cl ₂ -4-OCHF ₂
i-Pr	H	H	2, 5-Cl ₂ -3-OCHFCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	2, 6-Cl ₂ -3-OCHFCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	2, 3-Br ₂ -4-OCHFCF ₂ O-5
i-Pr	H	H	2, 3-Br ₂ -4-OCF ₂ CHFO-5
i-Pr	H	H	2, 5-Br ₂ -3-OCHFCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	2, 5-Br ₂ -3-OCF ₂ CHFO-4
i-Pr	H	H	2, 6-Br ₂ -3-OCHFCF ₂ O-4
i-Pr	H	H	2, 6-Br ₂ -3-OCF ₂ CHFO-4
i-Pr	H	H	2, 3, 4, 5, 6-F ₅
i-Pr	H	CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl
i-Pr	CH ₃	H	4-CF ₃
i-Pr	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-Cl
i-Pr	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
i-Pr	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	Et	H	4-OCF ₃
i-Pr	Et	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	i-Pr	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Pr	C(O)CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	C(O)Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	C(O)Ph	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	C(O)OCH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	C(O)OEt	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	SN(Bu-n) ₂	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	S(O) ₂ CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	NHC(O)CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
c-Pr	H	H	4-CF ₃
c-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
c-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂

91

92

c-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
c-Pr	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
c-Pr	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
n-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
n-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
n-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
i-Bu	H	H	4-CF ₃
i-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
i-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
i-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
i-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
i-Bu	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ Pr-c	H	H	2-CH ₃ -5-F
CH ₂ Pr-c	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
s-Bu	H	H	4-CF ₃
s-Bu	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
s-Bu	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
s-Bu	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
s-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
s-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
s-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
s-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
s-Bu	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
s-Bu	H	H	2-Et-4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	H
t-Bu	H	H	4-CF ₃
t-Bu	H	H	4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	4-C(CF ₃) ₂ OH
t-Bu	H	H	4-OCF ₃
t-Bu	H	H	4-SCF ₃
t-Bu	H	H	4-SCF ₂ Br
t-Bu	H	H	4-SO ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-F-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-F-4-OCF ₃
t-Bu	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
t-Bu	H	H	2-Br-4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-Cl
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ Br
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-S(O)CF ₃
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -5-Cl

93

94

t-Bu	H	H	2-Et-4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-Et-4-OCF ₃
t-Bu	H	H	2-(Pr-i)-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-CF ₃ -4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-OCH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2-OEt-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-SCH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	3-F-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	3-Cl-4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	3-OCF ₂ O-4
t-Bu	H	H	3-OCHFCF ₂ O-4
t-Bu	H	H	3-OCF ₂ CHFO-4
t-Bu	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4
t-Bu	H	H	3-OC(CF ₂ CF ₃)=N-4
t-Bu	H	H	3-N=C(CF ₂ CF ₃)O-4
t-Bu	H	H	3-N=C(CF ₂ CF ₂ CF ₃)O-4
t-Bu	H	H	3-N=C(Ph-4-CF ₃)O-4
t-Bu	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5
t-Bu	H	H	2-Cl-3-OCF ₂ CF ₂ O-4
t-Bu	H	H	2-Cl-3-N=C(CF ₃)O-4
t-Bu	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5
t-Bu	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ CF ₂ O-5
t-Bu	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	2,3-(CH ₃) ₂ -4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃ -5-Cl
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃ -5-CH ₃
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂ -5-F
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-OCHFCF ₂ O-5
t-Bu	H	H	2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-OCF ₂ O-3-4-Cl
t-Bu	H	H	2-OCF ₂ O-3-4,6-Cl ₂
t-Bu	H	CH ₃	4-OCF ₃
c-Bu	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
c-Bu	H	H	2-CH ₃ -5-F
c-Bu	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
n-Pen	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CH ₃)Et	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Et) ₂	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Et) ₂	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH(CH ₃)Pr-n	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)Pr-i	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)Pr-i	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
C(CH ₃) ₂ Et	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ Et	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ Et	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
C(CH ₃) ₂ Et	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₂ CH ₂ Pr-i	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
c-Pen	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
c-Pen	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂

95			96
c-Pen	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
n-Hex	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
c-Hex	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ Hex-c	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ F	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
CH ₂ CH ₂ F	H	H	2-CH ₃ -5-F
CH ₂ CH ₂ Cl	H	H	2-CH ₃ -5-F
CH ₂ CF ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CF ₃	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
(S)-CH(CH ₃)CH ₂ F	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
(R)-CH(CH ₃)CH ₂ Br	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
(S)-CH(CH ₃)CH ₂ Br	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ Br	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ Br	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
C(CH ₃) ₂ CHBrCH ₂ Br	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
CH ₂ CH ₂ OEt	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ OEt	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(OH)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(OH)Et	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(OH)Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH(OH)CH ₂ Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
(R)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
(S)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
CH(Et)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Ph)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
(R)-CH(Ph)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Ph-2-Cl)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Ph-4-Cl)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(Ph-4-Ph)CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₂ CH(OEt) ₂	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ SCH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ SCH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₂ SCH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SCCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SCCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SCCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃

97			98
CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Pr-n	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SEt	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SEt	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₂ CH ₂ SPr-i	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SPr-i	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ SPr-i	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SH	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	4-OCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -3-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-Cl
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
(R)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
(S)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OC(CF ₂ CF ₃)=C(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45d)
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-SCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-Si(CH ₃) ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -5-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Et-4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-OCH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂ CF ₂ O-5
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ CHFO-5
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂ -5-F
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	Et	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃

101

102

$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{O})\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{O})\text{NHEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{O})\text{N}(\text{Et})_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{S})\text{NHCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{S})\text{NHEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SC}(\text{S})\text{N}(\text{CH}_3)_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Et})_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Et})_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Et})_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SCH}_2(\text{Ph}-2,4\text{-Cl}_2)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SPh}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SPh}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SPh}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SPh}$	H	H	2-Et-4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{L}-8\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2(\text{L}-8\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{L}-36\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{O})(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{O})(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2(\text{L}-45\text{a})$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{L}-48\text{c})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{S}(\text{O})(\text{L}-48\text{c})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SO}_2(\text{L}-48\text{c})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SSCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{SS}(\text{Ph}-2\text{-NO}_2)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_2\text{SCH}_3)_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_2\text{SCH}_3)_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{Ph})\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{Ph})\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{Ph})\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{SO}_2\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	4-SO ₂ N(Et) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2,4-Cl ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-Br
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃

103			104
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(CF ₃) ₂ OH
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(CF ₃) ₂ OCH ₃
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OSO ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CH ₂ (Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CH(OH)(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(O)(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(O)N(CH ₃)(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(=NOH)(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(=NOCH ₃)(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-O(Ph-3-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-O(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-O(Ph-3-CN)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45d)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-S(Ph-3-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₂ OH-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	3-CF ₂ OCF ₂ O-4
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-Cl-3-CF ₂ OCF ₂ O-4
$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	H	H	2-CH ₃ -3-F-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$(-)-C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$(+)-C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(CF ₃) ₂ OCH ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OSO ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45d)
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2S(O)CH_3$	H	H	2-CH ₃ -3-F-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-Cl-4-OCF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-C(CF ₃) ₂ OCH ₃
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-(Ph-4-Cl)
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45d)

107			108
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{S}(\text{O})\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{S}(\text{O})\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{S}(\text{O})\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SO}_2\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3\text{SO}_2\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2(\text{CH}_2)_3\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2(\text{CH}_2)_3\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2(\text{CH}_2)_3\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{S}(\text{O})\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{S}(\text{O})\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SO}_2\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_4\text{SO}_2\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-5	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-6	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
T-6	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-7	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-8	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-9	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-10	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-11	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-12	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-13	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-14	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-15	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
T-16	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(\text{O})\text{OEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-Cl
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₂ CHF ₂ OCF ₂ CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CHO}$	H	H	2-CH ₃ -4-O(L-45d)
$\text{CH}(\text{CHO})\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CHO})\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CHO})\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Et}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH=NOCH}_3$	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂

110

— 56 —

111

112

$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_3$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{Et})_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)\text{Ph}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{NHEt}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H	4-CF ₃
$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}=\text{CHPh}(\text{E})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CF}_2$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -5-Cl
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CH}$	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CPh}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-CH}_3)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-CF}_3)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-OCH}_3)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-4-OCF}_3)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-2,4-F}_2)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-2,4-Cl}_2)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}(\text{Ph-2,6-Cl}_2)$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{CNaph}$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}-(\text{L-1a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}-(\text{L-2a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}-(\text{L-45a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}-(\text{L-45b})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}\equiv\text{C}-(\text{L-46a})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH_2Ph	H	H	2-F-4-CF ₂ CF ₃
CH_2Ph	H	H	2-Cl-4-CF ₂ CF ₃
CH_2Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH_2Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH_2Ph	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH_2Ph	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH_2Ph	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH_2Ph	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH_2Ph	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH_2Ph	Et	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2(\text{Ph-2-F})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2(\text{Ph-2-F})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
$\text{CH}_2(\text{Ph-2-F})$	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2(\text{Ph-2-Cl})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
$\text{CH}_2(\text{Ph-2-Cl})$	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂

113

114

CH ₂ (Ph-2-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH ₂ (Ph-2-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
CH ₂ (Ph-3-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-3-Cl)	CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-4-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-2-CH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-2-CH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH ₂ (Ph-3-CH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-4-CH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-2-OCH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-3-OCH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-4-OCH ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-2-CF ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-4-OCF ₃)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-2,3-Cl ₂)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-2,4-Cl ₂)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ (Ph-3,4-Cl ₂)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ -(L-45a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ -(L-46a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ -(L-47a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)Ph	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
(R)-CH(CH ₃)Ph	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
(S)-CH(CH ₃)Ph	H	H	2-CH ₃ -4-OCHF ₂
CH(CH ₃)Ph	H	CH ₃	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)(Ph-2-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)(Ph-3-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)(Ph-4-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)-(L-1a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)-(L-3a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)-(L-45a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)-(L-45a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)-(L-45a)	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
C(CH ₃) ₂ Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ (Ph-3-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ (Ph-4-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ (Ph-2-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ (Ph-3-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ (Ph-4-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ -(L-46a)	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ -(L-46a)	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ OPh	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ O(Ph-2-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ O(Ph-3-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ O(Ph-4-Cl)	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ NHPh	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃

115

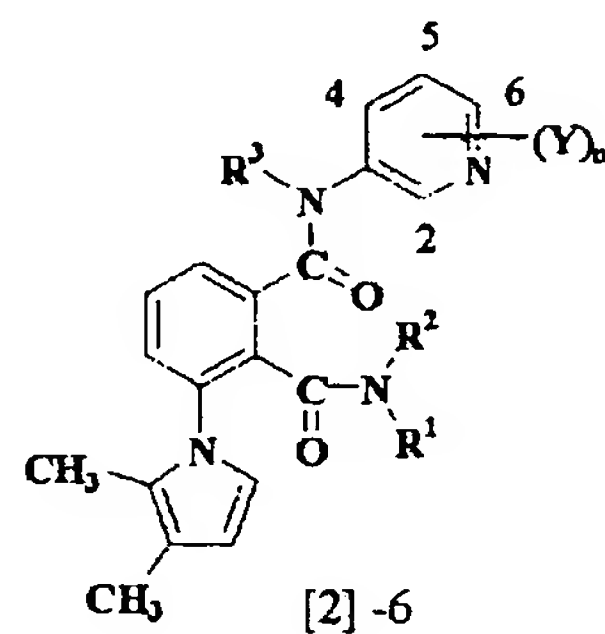
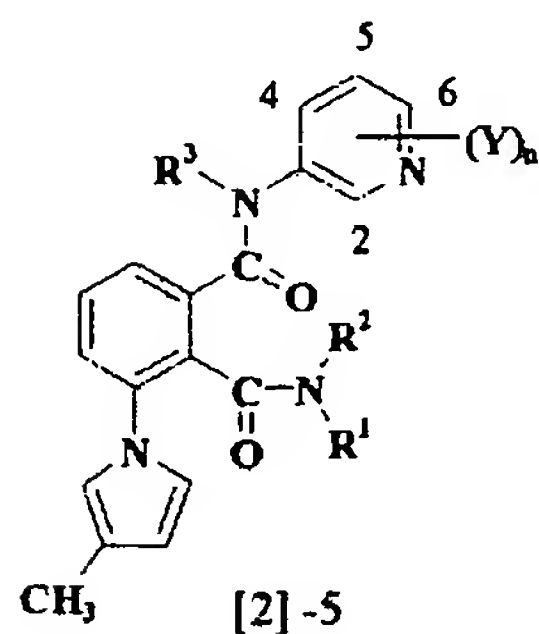
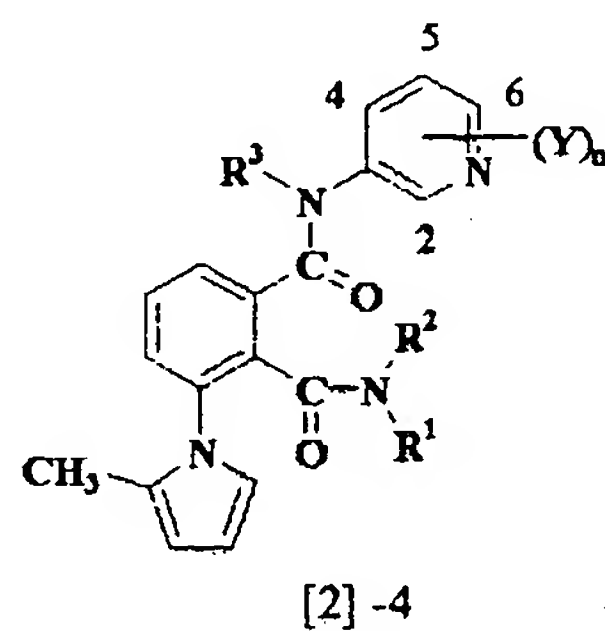
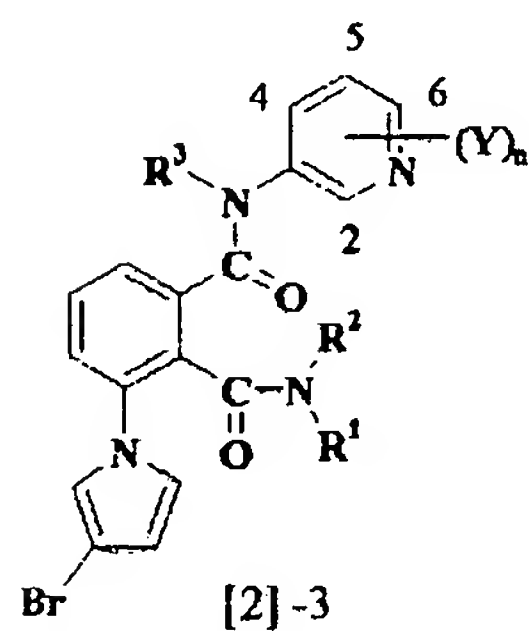
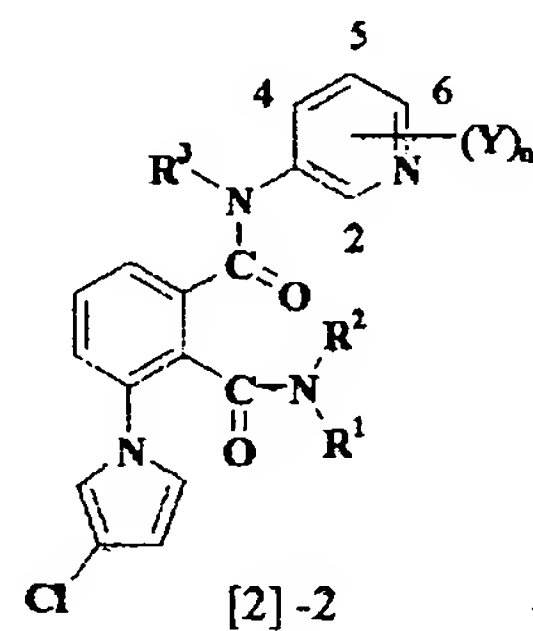
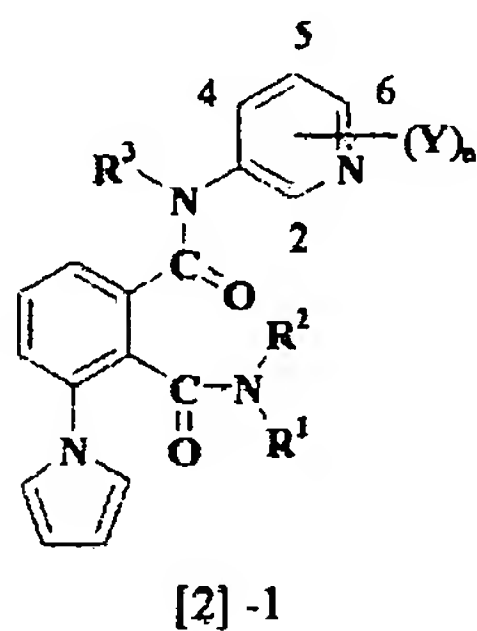
116

L-3a	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
M-4a	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
M-8a	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
M-9a	H	H	2-CH ₃ -4-OCF ₃
M-9b	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
M-19a	H	H	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
OPr-n	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	4-CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ -	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	H	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃

【0149】第2表
【0150】

* 【化36】

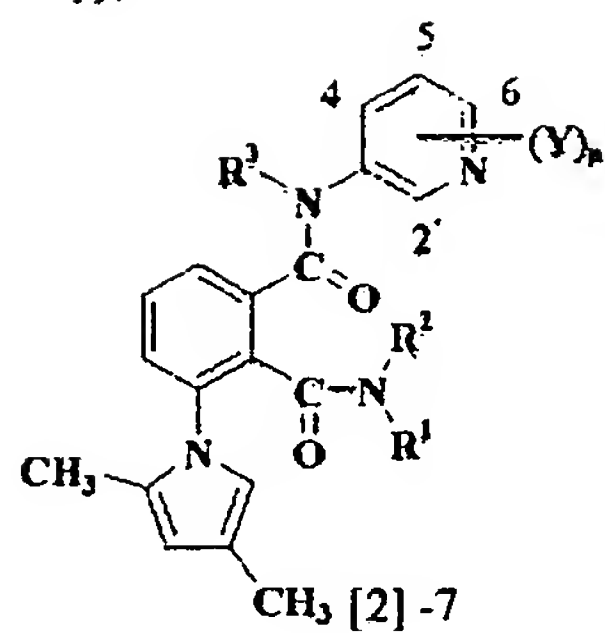
*



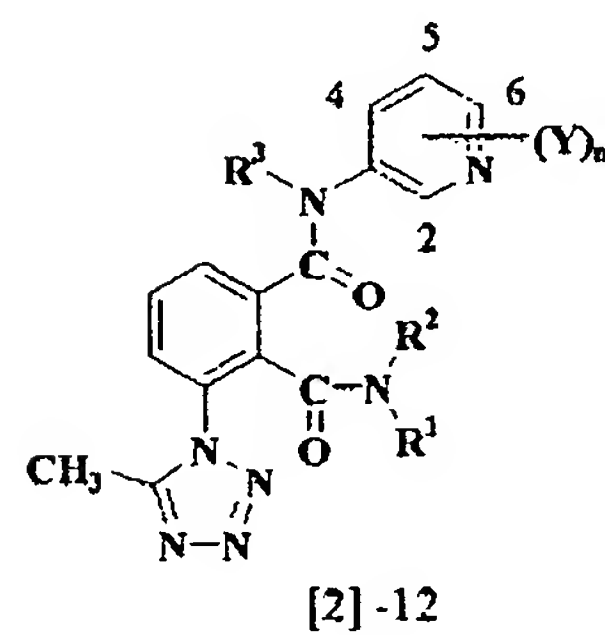
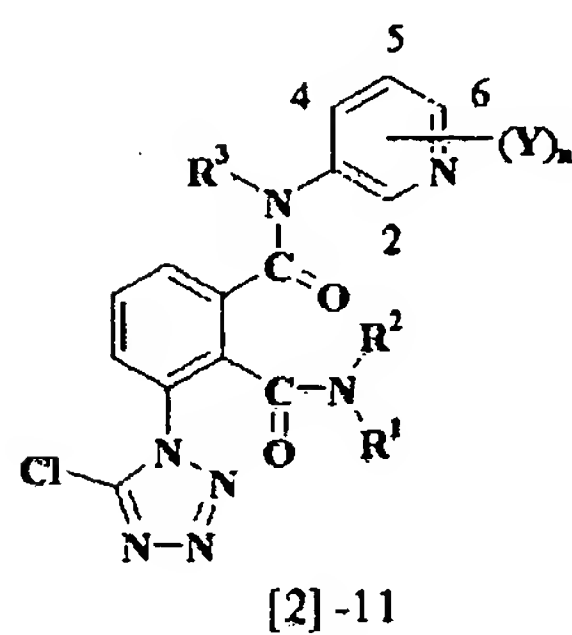
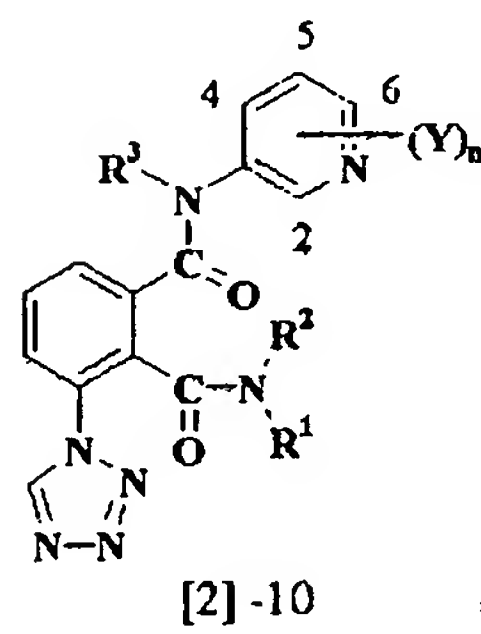
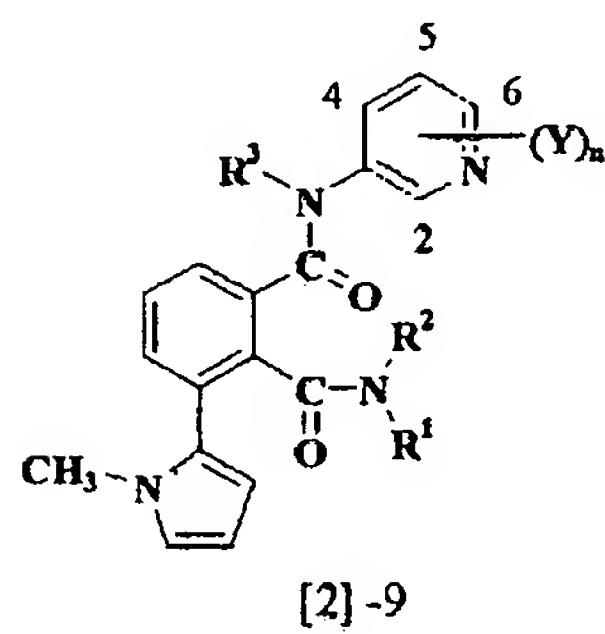
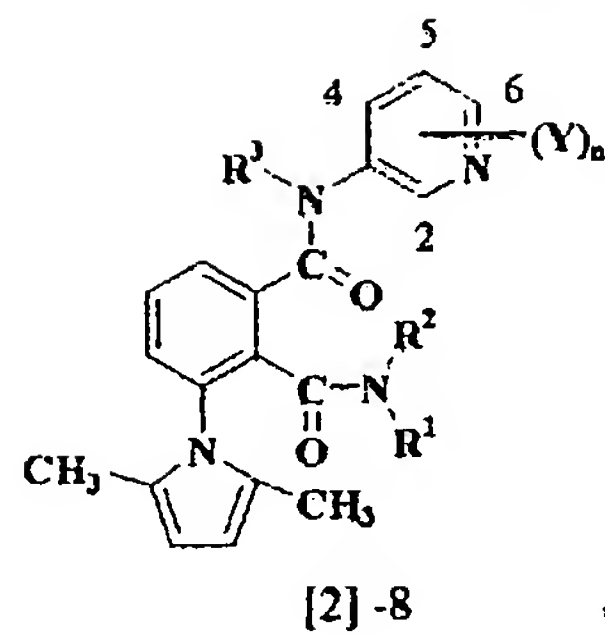
【0151】

【化37】

117



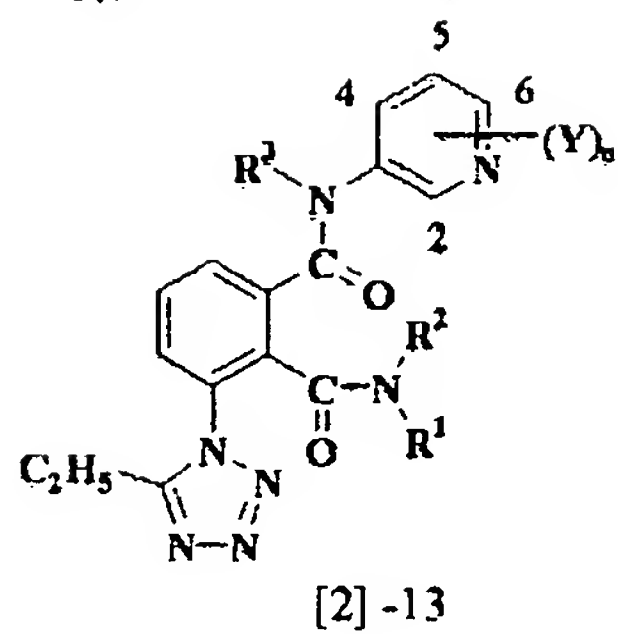
118



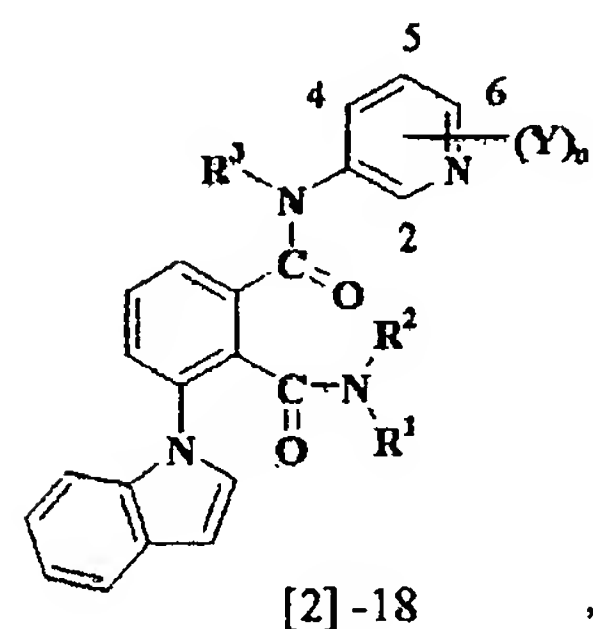
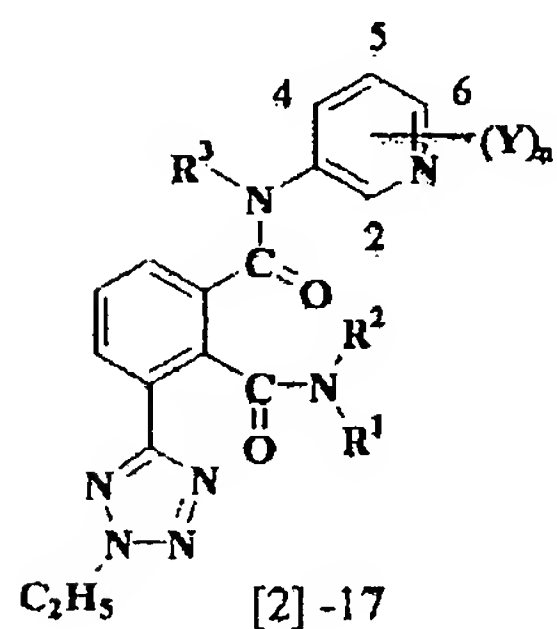
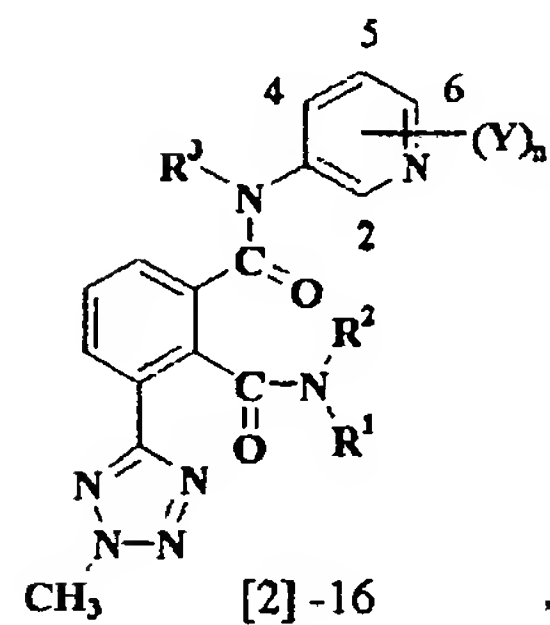
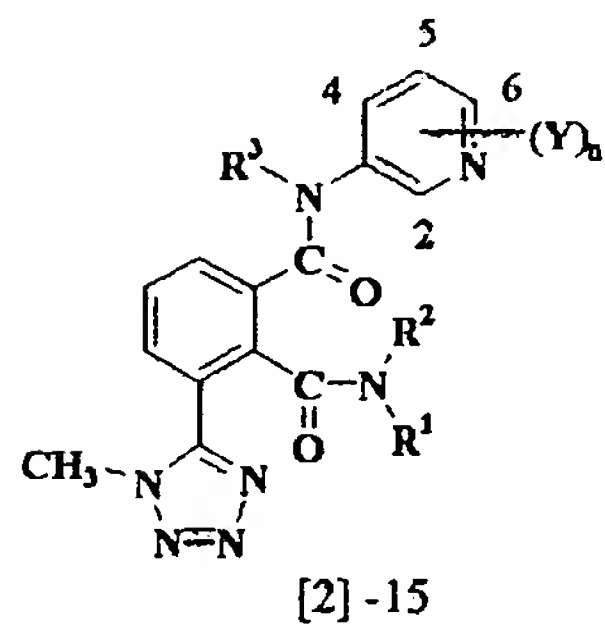
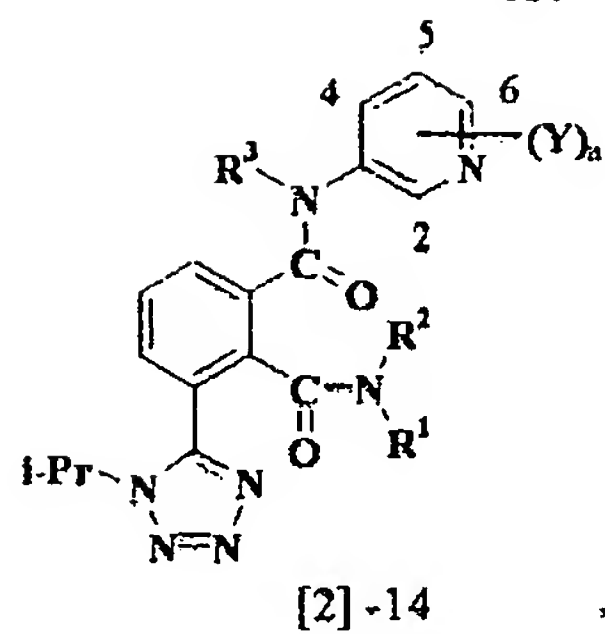
【0152】

【化38】

119

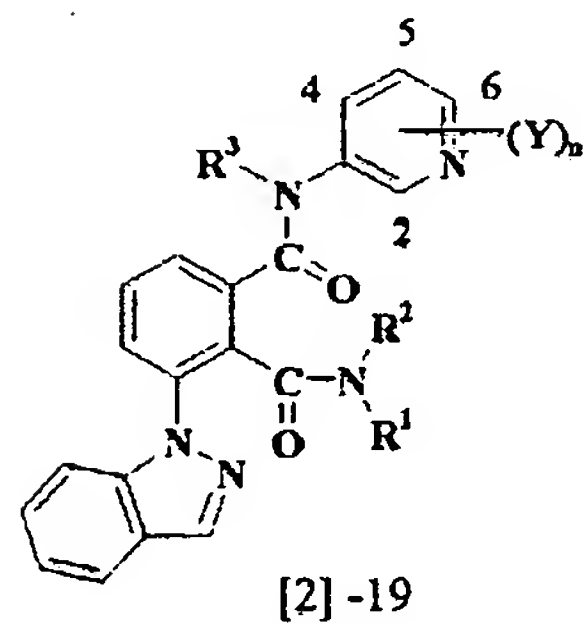


120

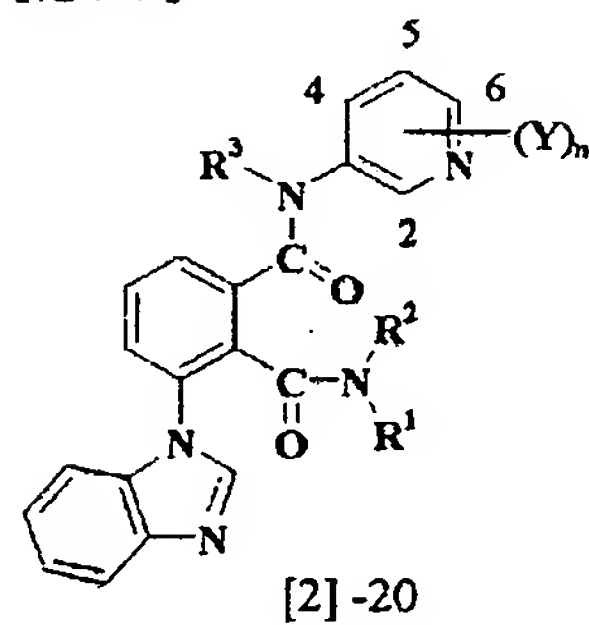


【0153】

【化39】



または



【0154】

【表2】

R ¹	R ²	R ³	(Y) _n
Et	Et	H	6-Cl
Et	Et	H	6-CF ₂ CF ₂ CF ₃
Et	Et	H	6-O(Ph-4-Br)
Et	Et	H	2-Cl-6-CF ₂ CF ₂ CF ₃
Et	Et	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂

121			122
Et	Et	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	H
i-Pr	H	H	4-SP <i>r</i> -i
i-Pr	H	H	4-SBu-i
i-Pr	H	H	6-Cl
i-Pr	H	H	6-CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	6-CF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	6-OCHF ₂
i-Pr	H	H	6-OCH(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	6-O(Ph-4-Br)
i-Pr	H	H	6-O(Ph-2,4-Cl ₂)
i-Pr	H	H	6-SP <i>r</i> -i
i-Pr	H	H	6-SBu-i
i-Pr	H	H	6-SCHF ₂
i-Pr	H	H	6-SO ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-6-OCF ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-6-OCH(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-Cl-6-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-OCHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHF ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-OCH ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHFCF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-O(Ph-4-CF ₃)
i-Pr	H	H	2-CH ₃ -6-SCHF ₂
i-Pr	H	H	2-OCH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-OCH(CF ₃) ₂ -6-CH ₃
i-Pr	H	H	2-SCH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	2-S(O)CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	4-CH ₃ -6-Cl
i-Pr	H	H	4-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	4-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
i-Pr	H	H	4-CH ₃ -6-O(Ph-4-Br)
n-Bu	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
i-Bu	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
s-Bu	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	6-CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	6-CF ₂ CF ₂ CF ₃
t-Bu	H	H	6-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
t-Bu	H	H	4-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-6-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂

123			124
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(CH ₃)CH ₂ SCCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	2-OCH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	H	4-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SEt	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ S(O)Et	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ Et	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	6-OCHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	6-SCHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-6-OCF ₂ CHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-Cl-6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHFOCF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-O(Ph-4-CF ₃)
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-SCHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-NHC(O)CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-OCH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-OCH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-OCH(CF ₃) ₂ -6-CH ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2-SCH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	4-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	4-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	2,4-Cl ₂ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-O(Ph-4-CF ₃)
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	2-OCH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	4-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	H	H	4-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	2-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	6-OCHF ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	2-Cl-6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	2-Cl-6-OCH(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	2-CH ₃ -6-OCHF ₂

125

$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H
$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	H
$CH(CH_3)CH=NOH$	H	H
$CH(CH_3)CH=NOCH_3$	H	H
$C(CH_3)_2CH=NOH$	H	H
$C(CH_3)_2CH=NOH$	H	H
$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	H	H
$C(CH_3)_2CH=NOCH_3$	H	H

126

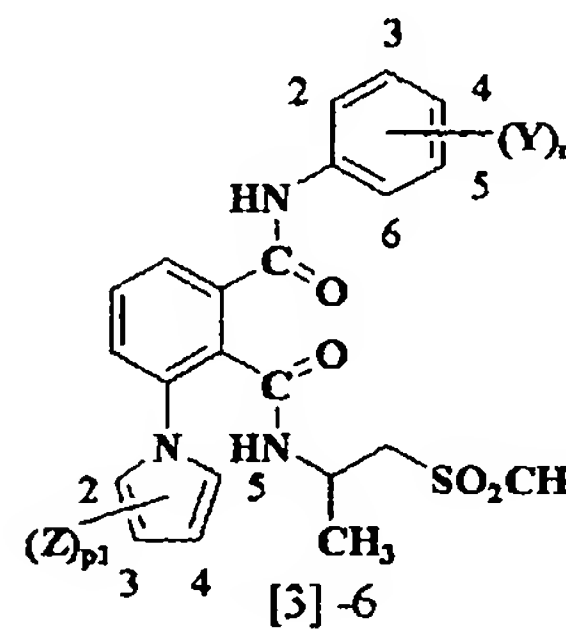
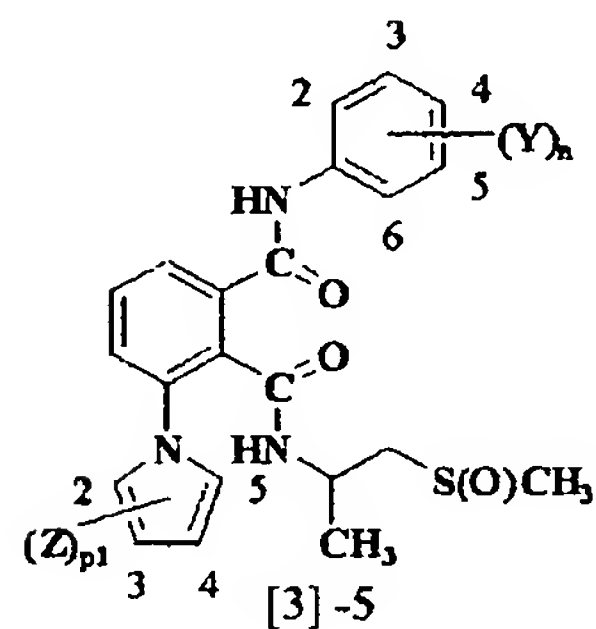
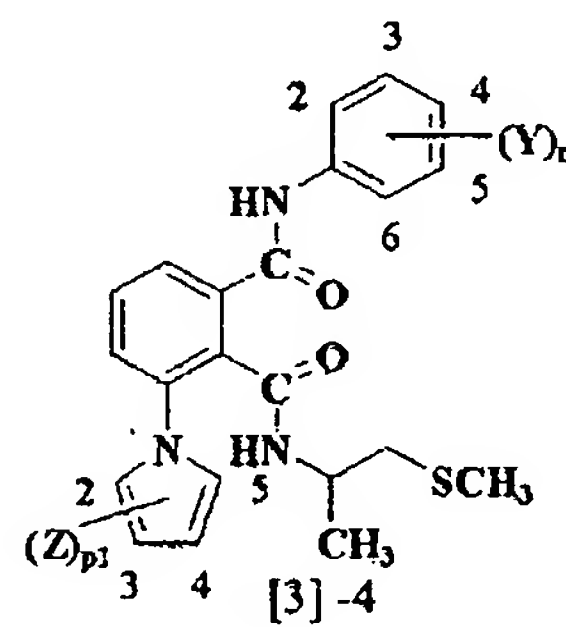
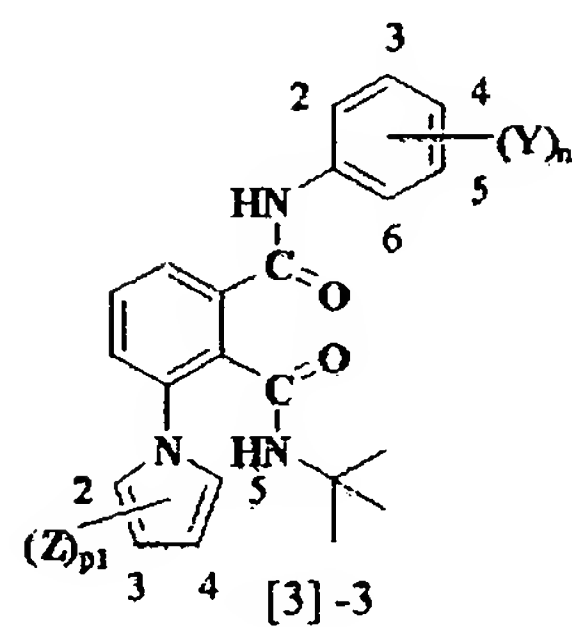
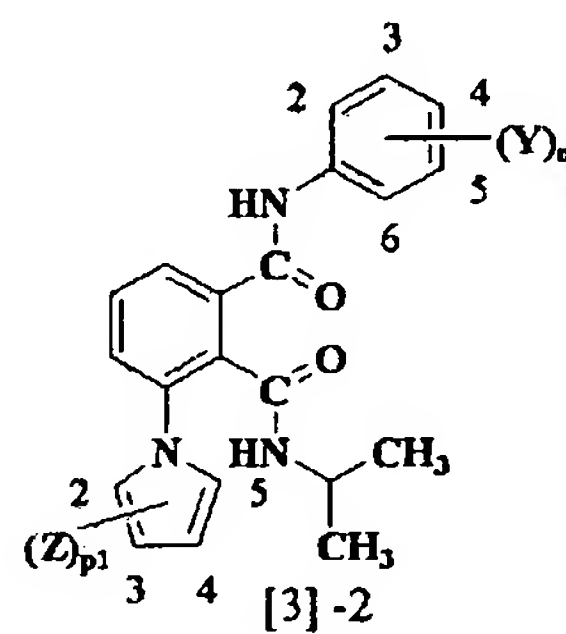
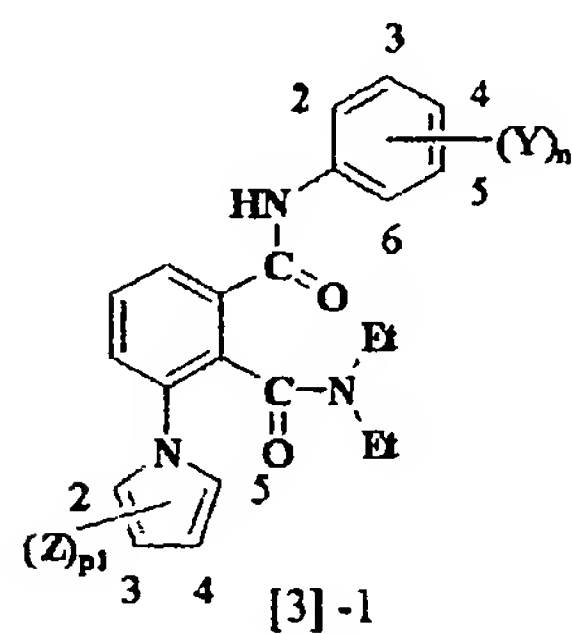
2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃
2-CH ₃ -6-O(Ph-4-CF ₃)
4-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
4-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -6-OCH(CF ₃) ₂

【0155】第3表

【0156】

*【化40】

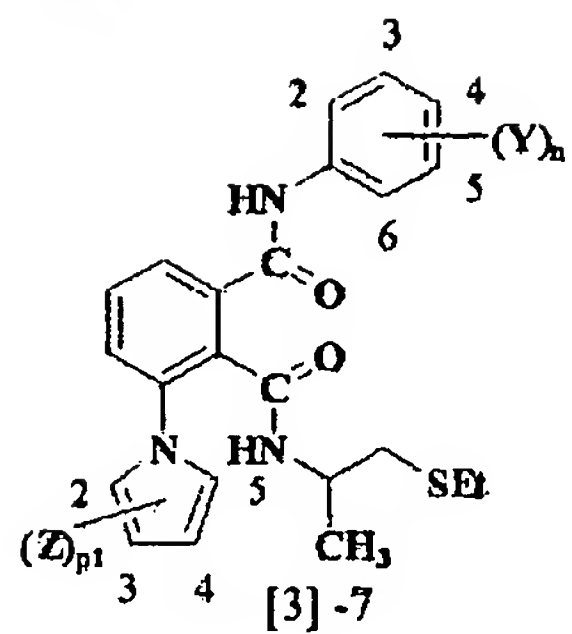
*



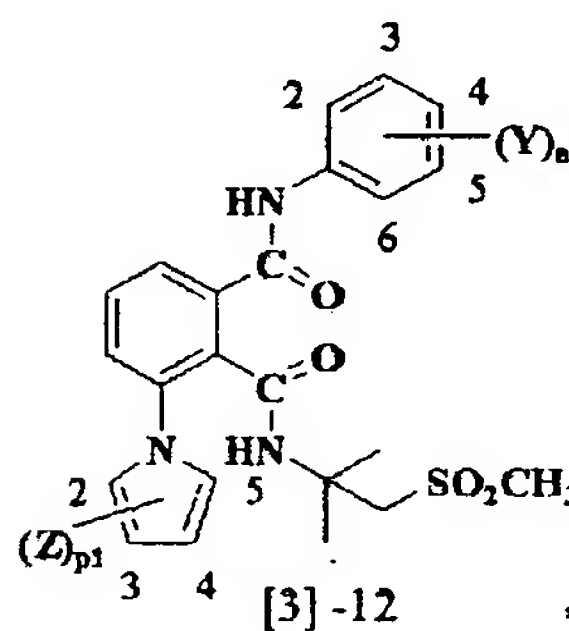
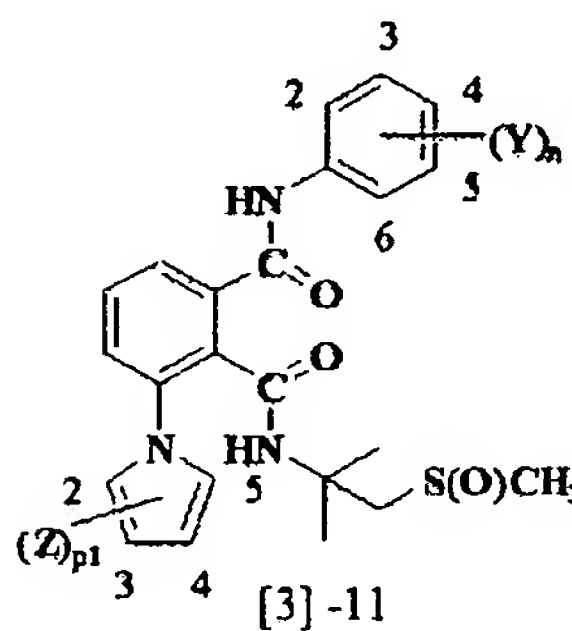
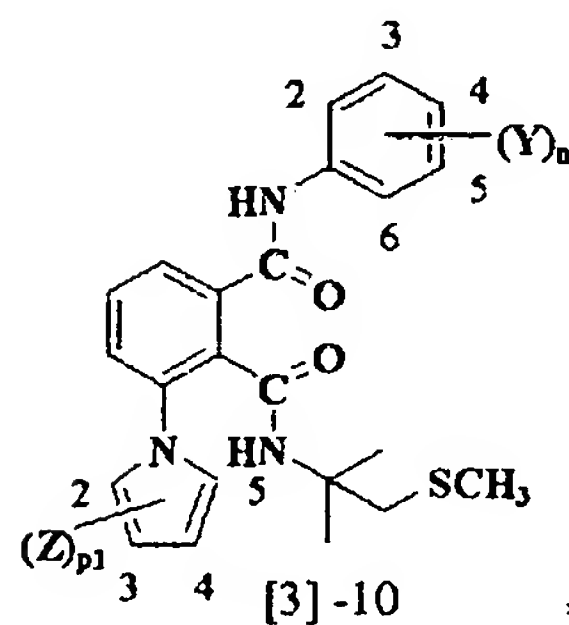
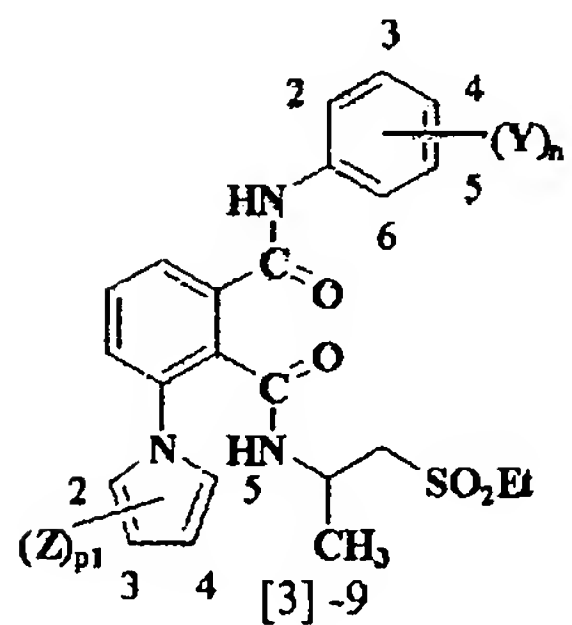
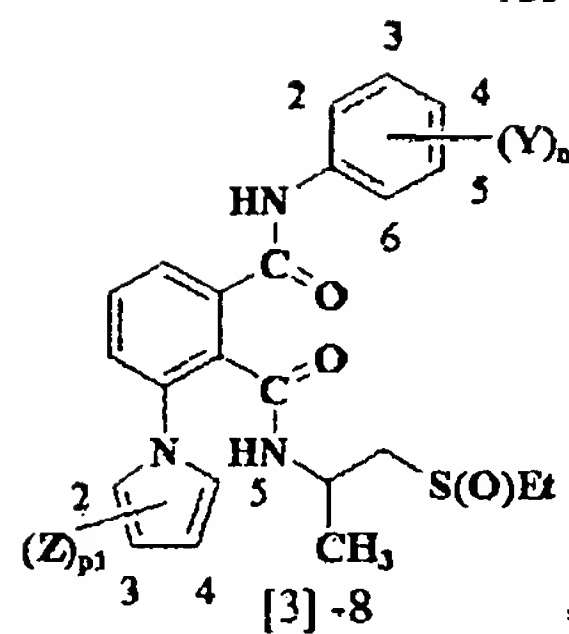
【0157】

【化41】

127



128



【0158】

【化42】

2-CH ₃ -3-CH ₂ C(O)OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-C(O)OEt-3-CH	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₃ -5-Et	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -3	2-CH ₃ -4-CF ₂ CF ₃
2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -3	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -3	2-CH ₃ -4-OCF ₃
2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(OH)-3	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(O)-3	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(=NOCH ₃)-3	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2,3,4-(CH ₃) ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2,4-(CH ₃) ₂ -3-C(O)OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2,5-(CH ₃) ₂ -3-C(O)OCH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2,3-(CH ₃) ₂ -3-SO ₂ CH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂
2-CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -3-4-CH ₃	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂

【0160】本発明化合物は、農園芸作物及び樹木などを加害する所謂農業害虫、家畜、家禽類に寄生する所謂家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与える所謂衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等を加害する所謂貯穀害虫、及び同様の場面で発生、加害するダニ

類、線虫類、軟体動物、甲殻類の何れの害虫も低濃度で有効に防除できる。

【0161】本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、線虫類、軟体動物及び甲殻類には具体的に、例えば、ワタアカミムシ、オオタバコガ、タバコガ、コットンボールワーム、タバコバッドワーム、コットンリーフワーム、ハスモンヨトウ、フォールアーミーワーム、シロイチモジヨトウ、サザンアーミーワーム、ソイビーンルーパー、キャベツジルーパー、ニカメイガ、コブノメイガ、ハイマダラノメイガ、アワヨトウ、ヨーロピアンコーンボーラー、タマナヤガ、カブラヤガ、ミカンハモグリガ、コドリガ、キンモンホソガ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、リンゴコカクモンハマキ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、グレープベリーモス、ヨトウガ、モンシロチョウ、コナガ、タバコホーンワーム、フタオビコヤガ、イチモンジセセリ、タマナギンウツバ、アメリカシロヒトリ等の鱗翅目害虫、ワタミゾウムシ、イネドロオイムシ、イネゾウムシ、イネミズゾウムシ、シバオサゾウムシ、アルファルファウィービル、グラナリーウィービル、メキシカンビーンビートル、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、アリモドキゾウムシ、サザンコーンルートワーム、ウエスタンコーンルートワーム、ノーザンコーンルートワーム、ニジュウヤホシテントウ、コロラドポテトビートル、ジャパニーズビートル、ウリハムシ、キスジノミハムシ、ドウガネブイブイ、ヒメコガネ、マメコガネ、タバコシバンムシ、コクヌストモドキ、チャイロコメノゴミムシダマシ、ゴマダラカミキリ、アオバアリガタハネカクシ、マツノマダラカミキリ、カンシャコメツキ、ヒメヒラタケシキスイ等の鞘翅目害虫、ホソヘリカメムシ、ミナミアオカメム

シ、アメリカコバネナガカメムシ、クサギカメムシ、クモヘリカメムシ、コバネヒョウタンナガカメムシ、シラホシカメムシ、ツマグロヨコバイ、ポテトリーフホッパー、フタテンオオヨコバイ、チャノミドリヒメヨコバイ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、トビイロウンカ、タバココナジラミ、シルバーリーフコナジラミ、ミカンキジラミ、ナシキジラミ、ミカンコナジラミ、ツツジゲンバイ、オンシツコナジラミ、ワタアブラムシ、ユキヤナギアブラムシ、モモアカアブラムシ、ミカンコナカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、イセリアカイガラムシ、ヤノネカイガラムシ、オオワラジカイガラムシ、ルビーロウムシ、ナガメ、ナンキンムシ等の半翅目害虫、ミナミキイロアザミウマ、ネギアザミウマ、ミカンキイロアザミウマ、ヒラズハナアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等の総翅目害虫、イネヒメハモグリバエ、マメハモグリバエ、ナスハモグリバエ、タネバエ、アップルマゴット、ヘシアンフライ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、チチュウカイミバエ、イエバエ、サシバエ、ヒツジシラミバエ、キスジウシバエ、ウシバエ、ヒツジバエ、ツエツエバエ、キアシオオブユ、ウシアブ、オオチョウバエ、トクナガクロヌカカ、アカイエカ、ヒトスジシマカ、ネッタイシマカ、ハマダラカ等の双翅目害虫、カブラハバチ、マツノキハバチ、クリハバチ、ゲンタイアリ、クロオオアリ、オオスズメバチ、ブルドックアント、ファイヤーアント、ファラオアント等の膜翅目害虫、クロゴキブリ、ヤマトゴキブリ、チャバネゴキブリ等の網翅目害虫、トノサマバッタ、コバネイナゴ、サバクワタリバッタ、エンマコオロギ、ケラ等の直翅目害虫、イエシロアリ、ヤマトシロアリ、タイワンシロアリ等のシロアリ目害虫、ネコノミ、ヒトノミ、ケオブスネズミノミ等の等翅目害虫、ニワトリオオハジラミ、ウシハジラミ等のハジラミ目害虫、ウシジラミ、ブタジラミ、ウシホソジラミ、ケブカウシジラミ等のシラミ目害虫、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ナミハダニ、カンザワハダニ等のハダニ類、ミカンサビダニ、ニセナシサビ

ダニ、チューリップサビダニ、チャノナガサビダニ等のフシダニ類、チャノホコリダニ、シクラメンホコリダニ等のホコリダニ類、ケナガコナダニ、ロビンネダニ等のコナダニ類、ミツバチヘギイタダニ等のハチダニ類、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等のマダニ類、ヒツジキュウセンダニ等のキュウセンダニ類、ヒゼンダニ等のヒゼンダニ類、サツマイモネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ、キタネグサレセンチュウ、クルミネグサレセンチュウ、ジャガイモシストセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、マツノザイセンチュウ等の線虫類、スクミリンゴガイ、ナメクジ、ウスカワマイマイ、ミスジマイマイ等の軟体動物、オカダンゴムシ等の甲殻類、等が挙げられるが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

【0162】さらに、本発明化合物は、有機燐系化合物、カーバメート系化合物又はピレスロイド系化合物等の既存の殺虫剤に対して抵抗性の発達した害虫に対しても有効である。

【0163】すなわち、本発明化合物は、直翅目、アザミウマ目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、網翅目、等翅目、シロアリ目、ダニ・シラミ類及び線虫類の害虫を低濃度で有効に防除することが出来る。一方、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殻類及び益虫に対してほとんど悪影響の無い極めて有用な特長を有している。

【0164】本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤および分解防止剤等を添加して、液剤 (soluble concentrate)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水和剤 (wettable powder)、水溶剤 (water soluble powder)、顆粒水和剤 (water dispersible granule)、顆粒水溶剤 (water soluble granule)、懸濁剤 (suspension concentrate)、乳濁剤 (emulsion, oil in water)、サスポエマルジョン (suspoemulsion)、マイクロエマルジョン (microemulsion)、粉剤 (dustable powder)、粒剤 (granule) およびゲル剤 (gel) 等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を、水溶性カプセルおよび水溶性フィルムの袋等の水溶性包装体に封入して供することもできる。

【0165】固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成シリカならびに合成シリケートが挙げられる。

【0166】液体担体としては、例えばエチレングリコ

ール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、γ-ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドンおよびN-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

【0167】これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0168】界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキsproピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸およびリン酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸およびリン酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびペタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

【0169】これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05~20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0170】本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異は有るが、一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり0.005~50kg程度が適当である。

【0171】次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0172】〔水和剤〕

本発明化合物	0.1~80部
固体担体	5~98.9部
界面活性剤	1~10部
その他	0~5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

【0173】〔乳剤〕

135

本発明化合物 0.1~30部
 液体担体 45~95部
 界面活性剤 4.9~15部
 その他 0~10部
 その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0174】〔懸濁剤〕

本発明化合物 0.1~70部
 液体担体 15~98.89部
 界面活性剤 1~12部
 その他 0.01~30部
 その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

【0175】〔顆粒水和剤〕

本発明化合物 0.1~90部
 固体担体 0~98.9部
 界面活性剤 1~20部
 その他 0~10部
 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0176】〔液剤〕

本発明化合物 0.01~70部
 液体担体 20~99.99部
 その他 0~10部
 その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

【0177】〔粒剤〕

本発明化合物 0.01~80部
 固体担体 10~99.99部
 その他 0~10部
 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0178】〔粉剤〕

本発明化合物 0.01~30部
 固体担体 65~99.99部
 その他 0~5部
 その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0179】次に、本発明化合物を有効成分とする製剤例をより具体的に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0180】尚、以下の配合例において、「部」は重量部を意味する。

【0181】〔配合例1〕水和剤

本発明化合物No. 1-01 20部
 パイロフィライト 74部
 ソルポール5039 4部
 （非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）
 カープレックス#80D 2部

136

（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

【0182】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物No. 1-01 5部
 キシレン 75部
 N-メチルピロリドン 15部
 ソルポール2680 5部

（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

10 以上を均一に混合して乳剤とする。

【0183】〔配合例3〕懸濁剤

本発明化合物No. 1-01 25部
 アグリゾールS-710 10部

（非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名）

ルノックス1000C 0.5部

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

キサンタンガム 0.2部

水 64.3部

以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

20 【0184】〔配合例4〕顆粒水和剤

本発明化合物No. 1-01 75部

ハイテノールNE-15 5部

（アニオン性界面活性剤：第一工業製薬（株）商品名）

バニレックスN 10部

（アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名）

カープレックス#80D 10部

（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

30

【0185】〔配合例5〕粒剤

本発明化合物No. 1-01 5部

ベントナイト 50部

タルク 45部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

【0186】〔配合例6〕粉剤

本発明化合物No. 1-01 3部

カープレックス#80D 0.5部

（合成含水珪酸：塩野義製薬（株）商品名）

カオリナイト 95部

リン酸ジイソプロピル 1.5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

【0187】使用に際しては、上記製剤を水で1~10000倍に希釈して、又は希釈せずに直接散布する。

【0188】また、本発明化合物を農薬として使用する場合には、必要に応じて製剤時又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤等と混合施用しても良い。

50

【0189】特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の低減による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大やより高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えばファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1999年版に記載されている化合物等が挙げられる。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみに限定されるものではない。

【0190】殺菌剤：アシベンゾラルーS-メチル (acibenzolar-S-methyl)、アシルアミノベンザミド (acylamino benzamide)、アンバム (amobam)、アムプロピルホス (ampropyfos)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、ベナラキシル (benalaxyl)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ベンチアゾール (benthiazole)、ベンザマクリル (benzamacril)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ビテルタノール (bitertanol)、ベトキサジン (bethoxazine)、ボルドー液 (bordeaux mixture)、ブラストサイジン-S (blasticidin-S)、プロモコナゾール (bromconazole)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオバート (buthiobate)、カルシウムポリスルフィド (calcium polysulfide)、キャプタフォル (captafol)、キャプタン (captan)、銅パーオキシクロリド (copper oxychloride)、カルプロパミド (carpropamid)、カルベンダジン (carbendazim)、カルボキシシン (carboxin)、CGA-279202 (試験名)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロベンチアゾン (chlobenthiazon)、クロルフエナゾール (chlorfenazol)、クロロネブ (chloroneb)、クロロタロニル (chlorothalonil)、クロゾリネート (chlozolate)、クフラネブ (cufraneb)、シモキサニル (cymoxanil)、シプロコナゾール (cyproconazole)、シプロジニル (cyprodinil)、シプロフラム (cyprofuram)、ダゾメット (dazomet)、デバカルブ (debacarb)、ジクロロフェン (dichlorophen)、ジクロブトラゾール (diclobutrazol)、ジクロフラニド (dichlofluanid)、ジクロメジン (diclomedine)、ジクロラン (dicloran)、ジエトフェンカルブ (diethofencarb)、ジクロシメット (diclocymet)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジフルメトリン (diflumerimol)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジニコナゾール (diniconazole)、ジニコナゾール-M (diniconazole-M)、ジノカップ (dinocap)、ジフェニルアミン (diphenylamine)、ジピリチオン (dipyrithione)、ジタリムホス (ditalimfos)、ジチアノン (dithianon)、ドデモルフ (dodemorph)、ドジン (dodine)、ドラゾク

ソロン (drazoxolon)、エデフェノホス (edifenphos)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、エチリモール (ethirimol)、エトリジアノール (etridiazole)、ファモキサゾン (famoxadone)、フェナリモール (fenarimol)、フェブコナゾール (febuconazole)、フェナミドン (fenamidone)、フェンダゾスラム (fendazosulam)、フェンフラム (fenfuram)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェンピクロニル (fencpiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、フェンチン (fentin)、フェルバン (ferbam)、フェリムゾン (ferimzone)、フルアジナム (fluazinam)、フルジオキソニル (fludioxonil)、フルオロイミド (fluoroimide)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル (flutolanil)、フルトリアフォル (flutriafol)、フォルペット (folpet)、フォセチル-アルミニウム (fosetyl-aluminium)、フベリダゾール (fuberidazole)、フララキシル (furalaxyl)、フラメトピル (furametpyr)、グアザチン (guazatine)、ヘキサクロロベンゼン (hexachlorobenzene)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、ヒメキサゾール (hymexazol)、イマザリル (imazalil)、イミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン (iminocytadine)、イブコナゾール (ibconazole)、イプロベンホス (iprobencfos)、イプロジオン (iprodione)、イソプロチオラン (isoprothiolane)、イプロバリカルブ (iprovalicarb)、カスガマイシン (kasugamycin)、クレソキシム-メチル (kresoxim-methyl)、マンカップ (mancopper)、マンコゼブ (mancozeb)、マンネブ (maneb)、メパニピリム (mepanipyrim)、メプロニル (mepronil)、メタラキシル (metalaxyl)、メトコナゾール (metconazole)、メタスルホカルブ (methasulfocarb)、メチラム (metiram)、メトミノストロビン (metominostrobin)、ミクロブタニル (myclobutanil)、MTF-753 (試験名)、ナバム (nabam)、ニッケルビス (ジメチルジチオカーバメート) (nickel bis(dimethyldithiocarbamate))、ニトロタール-イソプロピル (nitrothal-isopropyl)、ヌアリモール (nuarimol)、NNF-9425 (試験名)、オクチリノン (octhiline)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカルボキシシン (oxycarboxin)、オキポコナゾールフマル酸塩 (oxpoconazole fumarate)、ペフラゾエート (pefurzoate)、ペンコナゾール (pencconazole)、ペンシクロン (pencycuron)、フタライド (phthalide)、ピペラリン (piperalin)、ポリオキシシン (polyoxins)、炭酸水素カリウム (potassiumhydrogen carbonate)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarbhydrochlorid

e)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロピネブ(propineb)、ピラゾホス(pyrazophos)、ピリフェノックス(pyrifenox)、ピリメタニル(pirimethanil)、ピロキュロン(pyroquillon)、キノメチオネート(quinomethionate)、キノキシフェン(quinoxyfen)、キントゼン(quintozene)、RH7281(試験名)、炭酸水素ナトリウム(sodium hydrogen carbonate)、次亜塩素酸ナトリウム(sodium hypochlorite)、硫黄(sulfur)、スピロキサミン(spiroxamine)、テブコナゾール(tebuconazole)、テクナゼン(tecnazene)、テトラコナゾール(tetraconazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)、チアジアジン(thiadiazin/milneb)、チフルザミド(thifluzamide)、チオファネートーメチル(thiophanate-methyl)、チラム(thiram)、トルクロホスーメチル(tolclofos-methyl)、トリルフラニド(tolylfluanid)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(toriadimenol)、トリアゾキシド(triazoxide)、トリシクラゾール(tricyclazole)、トリデモルフ(tridemorph)、トリフルミゾール(triflumizole)、トリホリン(triforine)、トリチコナゾール(triticonazole)、バリダマイシン(validamycin)、ビンクロゾリン(vinclozolin)、硫酸亜鉛(zinc sulfate)、ジネブ(zineb)、ジラム(ziram)及びシイタケ菌糸体抽出物など。

【0191】殺バクテリア剤：ストレプトマイシン(streptomycin)、テクロフトラム(tecloftalam)、オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)及びオキシリニックアシド(oxolinic acid)など。

【0192】殺線虫剤：アルドキシカルブ(aldoxycarb)、カズサホス(cadusafos)、フォスチアゼート(fosthiazate)、フォスチエタン(fosthietan)、オキサミル(oxamyl)及びフェナミホス(fenamiphos)など。

【0193】殺ダニ剤：アセキノシル(acequinocyil)、アミトラズ(amitraz)、ビフェナゼート(bifenazate)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、チノメチオネート(chinomethionat)、クロロベンジラート(chlorobezilate)、クロフェンテジン(clofentezin)、サイヘキサチン(cyhexatine)、ジコフォール(dicofol)、ジエノクロール(dienochlor)、エトキサゾール(etoxazole)、フェナザキン(fenazaquin)、フェンブタチンオキシド(fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンプロキシメート(fenproximate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、ヘキシチアゾックス(hexythiazox)、ミルベメクチン(milbemectin)、プロパルギット(propargite)、ピリダベン(pyridaben)、ピリミジフェン(pyrimidifen)及びテブフェンピラド(tebufenpyrad)など。

【0194】殺虫剤：アバメクチン(abamectin)、アセフェート(acephate)、アセタミピリド(acetamipir

id)、アルディカルブ(aldicarb)、アレスリン(allethrin)、アジンホスーメチル(azinphos-methyl)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ビフェントリン(bifenthrin)、ブプロフェジン(buprofezin)、ブトカルボキシシン(butocarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、カルタップ(cartap)、クロルフェナピル(chlorfenapyr)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、クロチアニジン(clothianidin)、クロマフェノジド(chromafenozide)、クロピリホスーメチル(chlorpyrifos-methyl)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ベーターシフルトリン(beta-cyfluthrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、シロマジン(cyromazine)、シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダーシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、ジアフェンチウロン(diafenthion)、ダイアジノン(diazinon)、ジアクロデン(diaclofen)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジオフェノラン(diofenolan)、ジスルフトン(disulfoton)、ジメトエート(dimethoate)、エマメクチンベンゾエート(emamectin-benzoate)、EPN、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、エチプロール(ethiprole)、エトフェンプロックス(etofenprox)、エトリムホス(etrifos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェノキシカーブ(fenoxycarb)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フィプロニル(fipronil)、フルアクリピリム(flucrypyrim)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルフェノクスウロン(flufenoxuron)、フルフェンプロックス(flufenprox)、タウフルバリネート(tau-fluvalinate)、ホノホス(fonophos)、フォルメタネート(formetanate)、フォルモチオン(formothion)、フラチオカルブ(furathiocarb)、ハロフェノジド(halofenozide)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イソフェンホス(isofenphos)、インドキサカルブ(indoxacarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、イソキサチオン(isoxathion)、ルフエヌウロン(lufenuron)、マラチオン(malathion)、メタルデヒド(metaldehyde)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メタクリホス(methacrifos)、メタルカルブ(metalcarb)、メソミル(methomyl)、メソブレン(methoprene)、メトキシクロール(methoxychlor)、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、モノクロトホス(monoc

rotophos)、ムスカルーレ (muscalure)、ニジノテフ
ラン (nidinotefuran)、ニテンピラム (nitenpyra
m)、オメトエート (omethoate)、オキシデメトン-メ
チル (oxydemeton-methyl)、オキサミル (oxamyl)、
パラチオン (parathion)、パラチオン-メチル (parat
hion-methyl)、ペルメトリン (permethrin)、フェン
トエート (phenthoate)、フォキシム (phoxim)、ホレ
ート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット
(phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ピリ
ミカルブ (pirimicarb)、ピリミホス-メチル (pirimi
phos-methyl)、プロフェノホス (profenofos)、プロ
トリフェンブト (protrifenbute)、ピメトロジン (pym
etrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリプロキ
シフェン (pyriproxyfen)、ロテノン (rotenone)、ス
ルプロホス (sulprofos)、シラフルオフエン (silafllu
ofen)、スピノサド (spinosad)、スルホテップ (sulf
otep)、テブフェノジド (tebfenozide)、テフルベン
ズロン (teflubenzuron)、テフルトリン (tefluthori
n)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビンホス
(tetrachlorvinphos)、チアクロプリド (thiaclopri
d)、チオシクラム (thiocyclam)、チオジカルブ (thi
odicarb)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チオフ
ァノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、
トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トラロメスリン (t
ralomethrin)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリ
アズロン (triazuron)、トリフルムロン (triflumuro
n) 及びバミドチオン (vamidothion) など。

【0195】

【実施例】以下に本発明化合物の合成例、試験例を実施
例として具体的に述べることで、本発明をさらに詳しく
説明するが、本発明はこれらによって限定されるもので
はない。

【合成例】

【0196】合成例1

N¹- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェ
ニル)-N²-イソプロピル-3- (ピロール-1-イ
ル) フタル酸ジアミド (本発明化合物No. 1-01) 及
びN¹- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル
フェニル)-N²-イソプロピル-6- (ピロール-1-イ
ル) フタル酸ジアミド (本発明化合物No. 1-0
6)。

【0197】工程1; N- (4-ヘプタフルオロイソプ
ロピル-2-メチルフェニル)-3-ニトロフタル酸イ
ミドの製造。

3-ニトロフタル酸無水物4.94g及び4-ヘプタフル
オロイソプロピル-2-メチルアニリン7.05gを酢酸
50mlに溶解し、加熱還流下に3.5時間攪拌した。反
応完結後、減圧下に溶媒を留去し、残留した固体をイソ
プロピルエーテル-ヘキサン混合溶媒にて洗浄し、目的
物9.25gを類白色結晶として得た。

融点151.0~153.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.25 (dd, J=7.8,
0.6Hz, 1H), 8.21 (dd, J=7.8, 0.6Hz, 1H), 8.02 (t,
J=7.8Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.59 (d, J=8.7Hz, 1H),
7.31 (d, J=8.7Hz, 1H), 2.30 (s, 3H).

【0198】工程2; 3-アミノ-N- (4-ヘプタフル
オロイソプロピル-2-メチルフェニル) フタル酸イ
ミドの製造。

鉄粉2.57gを酢酸2ml及び水47mlに加え、70℃に
て攪拌下、N- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2
-メチルフェニル)-3-ニトロフタル酸イミド5.1
8gの酢酸37ml及び酢酸エチル104ml溶液を添加し
た。70℃にて3時間攪拌を継続した後、室温まで放
冷、水100ml及び酢酸エチル100mlを加えて不溶物
をセライト濾過にて除去した。濾液から有機層を分取、
飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄 (50ml x 5)
した後、飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水
・乾燥、減圧下に溶媒を留去することにより得られた
固体をジイソプロピルエーテル-ノルマルヘキサン混合
溶媒にて洗浄し、目的物3.81gを肌色結晶として得
た。

融点123.0~125.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7.59 (s, 1H), 7.56
(d, J=8.4Hz, 1H), 7.50 (dd, J=8.4, 7.2Hz, 1H), 7.
34 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.26 (dd, J=7.2, 0.6Hz, 1H),
6.94 (dd, J=8.4, 0.6Hz, 1H), 5.33 (bs, 2H), 2.30
(s, 3H).

【0199】工程3; N- (4-ヘプタフルオロイソプ
ロピル-2-メチルフェニル)-3- (ピロール-1-イ
ル) フタル酸イミドの製造。

3-アミノ-N- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-
2-メチルフェニル) フタル酸イミド3.39gの酢酸3
0ml溶液に2, 5-ジメトキシテトラヒドロフラン1.
07gを加え、加熱還流下に3時間攪拌した。反応完
結後、減圧下に溶媒を留去、残留固体をジイソプロピ
ルエーテルにて洗浄し、目的物2.03gを黄色結晶として
得た。

融点128.0~129.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7.90 (dd, J=7.5,
1.5Hz, 1H), 7.86 (t, J=7.5, 1.5Hz, 1H), 7.75 (dd,
J=7.5, 1.5Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.57 (d, J=8.7Hz,
1H), 7.36 (d, J=8.1Hz, 1H), 7.22 (t, J=2.1Hz, 2
H), 6.39 (t, J=2.1Hz, 2H), 2.30 (s, 3H).

【0200】工程4; N¹- (4-ヘプタフルオロイソプ
ロピル-2-メチルフェニル)-N²-イソプロピル-3-
(ピロール-1-イル) フタル酸ジアミド及びN¹-
(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニ
ル)-N²-イソプロピル-6- (ピロール-1-イル)
フタル酸ジアミドの製造。

50 N- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチル

エニル) - 3 - (ピロール-1-イル) フタル酸イミド
1.00gの1, 4-ジオキサン10ml溶液にイソプロピ
ルアミン10mlを添加し、80℃にて4時間攪拌した。
反応完結後室温まで放冷、減圧下に溶媒を留去、残留固
体をクロロホルムにて洗浄し、N¹ - (4-ヘプタフルオ
ロイソプロピル-2-メチルフェニル) - N² - イソプロ
ピル-6 - (ピロール-1-イル) フタル酸ジアミド
0.50gを白色結晶として得た。

融点217.0~220.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7.88 (dd, J=8.4,
6.0Hz, 1H), 7.4~7.55 (m, 4H), 7.41 (d, J=9.0Hz, 1
H), 7.34 (bs, 1H), 6.94 (t, J=2.1Hz, 2H), 6.36 (br,
2H), 6.32 (t, J=2.1Hz, 2H), 4.2~4.25 (m, 1H), 2.0
1 (s, 3H), 1.22 (d, J=6.6Hz, 6H)。

上記のクロロホルム洗浄液を回収、減圧下にて溶媒を留
去し、残留物を酢酸エチル-ノルマルヘキサン (1:
2) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィー
にて精製し、N¹ - (4-ヘプタフルオロイソプロピル-
2-メチルフェニル) - N² - イソプロピル-3 - (ピロ
ール-1-イル) フタル酸ジアミド0.32gを白色結晶
として得た。

融点233.0~236.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9.12 (bs, 1H), 8.2
5 (d, J=7.8Hz, 1H), 7.88 (d, J=7.8Hz, 1H), 7.57
(t, J=7.8Hz, 1H), 7.45~7.55 (m, 2H), 7.44 (s, 1H),
6.91 (t, J=2.1Hz, 2H), 6.32 (t, J=2.1Hz, 2H), 5.59
(d, J=8.1Hz, 1H), 3.9~4.05 (m, 1H), 2.43 (s, 3H),
0.90 (d, J=6.6Hz, 6H)。

【0201】合成例2

3 - (2-クロロピロール-1-イル) - N¹ - (4-ヘ
プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) - N²
- イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物No. 1
- 02) 及び 3 - (2, 5-ジクロロピロール-1-イル)
- N¹ - (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メ
チルフェニル) - N² - イソプロピルフタル酸ジアミド
(本発明化合物No. 1-04)。

N¹ - (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフ
ェニル) - N² - イソプロピル-3 - (ピロール-1-イル)
フタル酸ジアミド (本発明化合物No. 1-01) 0.
39gのテトラヒドロフラン15ml溶液にN-クロロこ
はく酸イミド0.13gを添加し、室温にて15時間攪拌
した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留物に水1
5mlを加え、酢酸エチル100mlにて抽出した。有機層
を飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾
燥、減圧下にて溶媒を留去することにより得られた固体
を酢酸エチル-ノルマルヘキサン (1:3) にて溶出する
シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、3
- (2-クロロピロール-1-イル) - N¹ - (4-ヘ
プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) - N² -
イソプロピルフタル酸ジアミドの白色結晶0.14g、及

び 3 - (2, 5-ジクロロピロール-1-イル) - N¹ -
(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニ
ル) - N² - イソプロピルフタル酸ジアミドの白色結晶
0.08gをそれぞれ得た。

3 - (2-クロロピロール-1-イル) - N¹ - (4-ヘ
プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) - N²
- イソプロピルフタル酸ジアミド；

融点216.0~218.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9.05 (bs, 1H), 8.3
1 (dd, J=8.4, 4.8Hz, 1H), 8.05 (d, J=7.8Hz, 1H),
7.65 (t, J=7.8Hz, 1H), 7.50~7.45 (m, 2H), 7.43 (s,
1H), 6.81 (dd, J=3.0, 2.1Hz, 1H), 6.24 (dd, J=3.
9, 3.3Hz, 1H), 6.15~6.25 (m, 1H), 5.62 (d, J=7.2H
z, 1H), 3.90~4.00 (m, 1H), 2.42 (s, 3H), 0.80~1.00
(bs, 6H)。

3 - (2, 5-ジクロロピロール-1-イル) - N¹ -
(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニ
ル) - N² - イソプロピルフタル酸ジアミド；

融点217.0~219.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.99 (bs, 1H), 8.2
9 (dd, J=8.7, 4.4Hz, 1H), 8.11 (d, J=8.1Hz, 1H),
7.69 (t, J=8.1Hz, 1H), 7.40~7.50 (m, 3H), 6.19 (s,
2H), 5.77 (d, J=7.8Hz, 1H), 3.95~4.05 (m, 1H), 2.
42 (s, 3H), 0.95 (d, J=6.6Hz, 6H)。

【0202】合成例3

N¹ - (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフ
ェニル) - N² - イソプロピル-3 - (テトラゾール-1
-イル) フタル酸ジアミド (本発明化合物No. 1-0
8) 及び N¹ - (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-
メチルフェニル) - N² - イソプロピル-6 - (テトラゾ
ール-1-イル) フタル酸ジアミド (本発明化合物No.
1-09)。

【0203】工程1；N - (4-ヘプタフルオロイソプ
ロピル-2-メチルフェニル) - 3 - (テトラゾール-
1-イル) フタル酸イミドの製造。

3-ニトロフタル酸無水物より合成例1の工程1~2と
同様に合成した3-アミノ-N - (4-ヘプタフルオロ
イソプロピル-2-メチルフェニル) フタル酸イミド
2.0g及びオルトギ酸トリエチル1.3mlを室温下にて
30分攪拌した後、酢酸4.3ml及びアジ化ナトリウム
0.47gを加え、80℃にて更に2時間攪拌を継続し
た。反応完結後、室温まで放冷し水20mlにて希釈、酢
酸エチル20mlにて抽出し、有機層を飽和食塩水、無水
硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留
去した。残留固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄
し、目的物1.7gを白色結晶として得た。

融点178.0~179.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 400MHz) δ 9.87 (s, 1H), 8.46
(dd, J=8.0, 1.0Hz, 1H), 8.18 (dd, J=8.0, 1.0Hz, 1
H), 8.10 (t, J=8.0Hz, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.60 (d,

$J=8.3\text{Hz}$, 1H), 7.37 (d, $J=8.2\text{Hz}$, 1H), 2.30 (s, 1H).

【0204】工程2: N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-3-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミド及び N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミドの製造。

N -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-3-(テトラゾール-1-イル)フタル酸イミド0.7gの1, 4-ジオキサン20ml溶液にイソプロピルアミン0.18gを添加し、室温にて12時間攪拌した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留固体を酢酸エチルにて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、 N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-3-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミドの白色結晶0.15g、続いて N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミドの白色結晶0.30gをそれぞれ得た。

N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-3-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミド;

融点241.0~242.0℃

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6 , Me_4Si , 300MHz) δ 10.10 (s, 1H), 9.60 (s, 1H), 8.21 (d, $J=7.5\text{Hz}$, 1H), 7.95-8.0 (m, 1H), 7.8-7.85 (m, 3H), 7.5-7.55 (m, 2H), 3.65-3.8 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 0.80 (d, $J=6.3\text{Hz}$, 6H).

N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミド;

融点216.0~217.0℃

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6 , Me_4Si , 300MHz) δ 9.94 (s, 1H), 9.74 (s, 1H), 8.48 (d, $J=7.7\text{Hz}$, 1H), 7.75-7.95 (m, 3H), 7.4-7.55 (m, 3H), 3.95-4.1 (m, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.15 (d, $J=6.6\text{Hz}$, 6H).

【0205】合成例4

3-(2, 5-ジメチル-3-トリフルオロアセチルピロール-1-イル)- N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミド (本発明化合物No. 1-05)。

【0206】工程1: 2-(2, 5-ジメチルピロール-1-イル)- N -イソプロピルベンズアミドの製造。
2-アミノ- N -イソプロピルベンズアミド6.46gのトルエン70ml溶液に2, 5-ヘキサジオン5.0g及び酢酸7mlを加え、加熱還流下にて15時間攪拌した。反応完結後室温まで放冷し酢酸エチル100mlにて希釈、有機層を水(100ml)、1N塩酸(100ml)、水(50ml)、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(100ml)の順で洗浄した後、飽和食塩水、無水硫酸ナトリウ

ムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留する暗赤色油を酢酸エチル-ノルマルヘキサン(1:4)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物5.56gを白色結晶として得た。

融点91.0~92.5℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) δ 8.24-8.30 (m, 1H), 7.51-7.59 (m, 2H), 7.19-7.24 (m, 1H), 6.00 (s, 2H), 4.81 (bs, 1H), 3.97-4.10 (m, 1H), 1.94 (s, 6H), 0.94 (d, $J=6.4\text{Hz}$, 6H).

10 【0207】工程2: 3-(2, 5-ジメチルピロール-1-イル)-2-イソプロピルカルバモイル安息香酸の製造。

2-(2, 5-ジメチルピロール-1-イル)- N -イソプロピルベンズアミド2.56gのテトラヒドロフラン30ml溶液に、-78℃にて攪拌下、0.99Mセカンダリーブチルリチウムヘキサン溶液20mlを滴下した。-78℃にて30分攪拌を継続した後、室温にて30分間炭酸ガスを吹き込んだ。室温にて更に30分攪拌を継続した後、氷冷下、水100mlを加え、濃塩酸を加えてpHを2~3に調節し、酢酸エチルにて抽出(100ml x 3)、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留する黄色固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物2.58gをクリーム色結晶として得た。

20 【0208】工程3: 3-(2, 5-ジメチル-3-トリフルオロアセチルピロール-1-イル)- N^1 -(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- N^2 -イソプロピル-6-(テトラゾール-1-イル)フタル酸ジアミドの製造。

3-(2, 5-ジメチルピロール-1-イル)-2-イソプロピルカルバモイル安息香酸4.52gのトルエン100ml溶液に、室温にて攪拌下、無水トリフルオロ酢酸4.25gを滴下した。同温度にて30分攪拌した後、減圧下に溶媒を留去、残留物をアセトニトリル110mlに溶解し、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリン4.13g及びトリフルオロ酢酸10滴を加え、室温にて一夜攪拌を継続した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留固体を酢酸エチル-ノルマルヘキサン(1:6)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物0.58gを白色結晶として得た。

融点238.5~239.5℃

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3 , Me_4Si , 400MHz) δ 8.69 (bs, 1H), 8.22 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 1H), 8.03 (d, $J=8.0\text{Hz}$, 1H), 7.71 (t, $J=8.0\text{Hz}$, 1H), 7.46 (d, $J=8.8\text{Hz}$, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.40 (dd, $J=8.0, 1.2\text{Hz}$, 1H), 6.47 (q, $J=1.2\text{Hz}$, 1H), 5.59 (d, $J=8.4\text{Hz}$, 1H), 3.87-4.00 (m, 1H), 2.38 and 2.39 (s, 6H), 2.05 and 2.06 (s, 3H), 0.85 and 0.88 (d, $J=6.6\text{Hz}$, 6H).

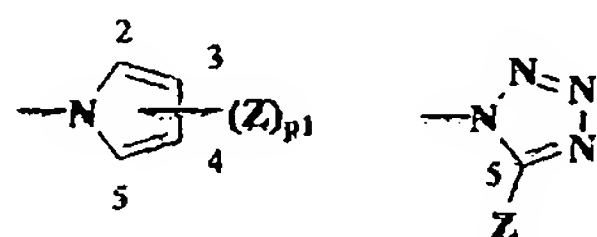
50 【0209】本発明化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。そのような化合物の例を

第4表に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0210】また、表中i-Prはイソプロピルを表し、X¹-1及びX¹-4はそれぞれ下記の構造を表す。

【0211】

【化43】



X¹-1

X¹-4

10

【0214】

【表4】

【0212】第4表

*

No.	X ¹	(Z) _{p1}	R ¹	(Y) _n	m. p. (°C)
1-01	3-(X ¹ -1)	H	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	233.0-236.0
1-02	3-(X ¹ -1)	2-Cl	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	216.0-218.0
1-03	3-(X ¹ -1)	2-Br	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	179.0-181.0
1-04	3-(X ¹ -1)	2,5-Cl ₂	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	217.0-219.0
1-05	3-(X ¹ -1)	2,5-(CH ₃) ₂ - 3-C(O)CF ₃	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	238.5-239.5
1-06	6-(X ¹ -1)	H	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	217.0-220.0
1-07	6-(X ¹ -1)	2,5-(CH ₃) ₂	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	185.0-187.0
1-08	3-(X ¹ -4)	H	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	241.0-242.0
1-09	6-(X ¹ -4)	H	i-Pr	2-CH ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	216.0-217.0

【0215】【試験例】次に、本発明化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらにのみ限定されるものではない。

【0216】試験例1 ハスモンヨトウに対する殺虫試験

本発明化合物の10%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ（*Spodoptera litura*）の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、下記の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2区制で行なった。

死虫率（%）＝（死虫数／放虫数）×100

その結果、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No.：1-01、1-06、1-08

【0217】試験例2 コナガに対する殺虫試験

本発明化合物の10%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ

（*Plutella xylostella*）の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2区制で行なった。その結果、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No.：1-01、1-02、1-03、1-06、1-07、1-08

【0218】

【発明の効果】殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来の殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。また、殺虫剤の一部には毒性の高いもの、長く環境中に残留するものが存在し、これらによる生態系の攪乱が問題となっている。一方、本発明化合物は多くの農業害虫、ハダニ類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、既存の殺虫剤に対して抵抗性を獲得した害虫に対しても十分な防除効果を発揮する。さらに、ホ乳類、魚類及び益虫に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で環境に対する負荷も軽い。

【0219】従って、本発明は有用な新規有害生物防除剤を提供することができる。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. ⁷	識別記号	F I	フ-ワード (参考)
A O 1 N 43/713		A O 1 N 43/713	
47/24		47/24	A
57/24	1 0 2	57/24	1 0 2 Z
	1 0 3		1 0 3 A
	1 0 4		1 0 4
A 6 1 K 31/402		A 6 1 K 31/402	
31/41		31/41	
A 6 1 P 33/14		A 6 1 P 33/14	
C O 7 D 207/333		C O 7 D 207/333	
207/34		207/34	
257/04		257/04	A
(72)発明者 三宅 敏郎		F ターム (参考)	4C069 AC05 AC06 AC07 AC08 BA01
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産			BA08 BB02 BB08 BB15 BB16
化学工業株式会社生物科学研究所内			BB22 BB28 BB45 BB49 BB56
(72)発明者 瀧井 新自			BC01 BD03 BD09
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産		4C086	AA01 AA02 AA03 BC05 BC13
化学工業株式会社生物科学研究所内			BC17 BC62 GA07 GA08 MA01
(72)発明者 伊藤 俊紀			MA04 MA17 MA22 MA23 MA28
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産			MA37 MA41 MA43 MA63 NA07
化学工業株式会社生物科学研究所内			NA14 ZB37 ZC61
		4H011	AC01 BA01 BB09 BB13 BB17
			BC01 BC07 BC09 BC17 BC18
			BC19 BC20 DA02 DA15 DA16
			DC01 DC04 DC05 DC06 DC08
			DH03 DH14